



Europäisches Patentamt
European Patent Office
Office européen des brevets

Veröffentlichungsnummer:

0 135 472
B1

12

EUROPÄISCHE PATENTSCHRIFT

Veröffentlichungstag der Patentschrift:
18.01.89

Anmeldenummer: 84810353.7

Anmeldetag: 19.07.84

Int. Cl.: **C 07 D 239/42, C 07 D 239/46,**
C 07 D 239/52, C 07 D 239/56,
C 07 D 401/12, A 01 N 43/54

N-(2-Nitrophenyl)-2-aminopyrimidin-Derivate, deren Herstellung und Verwendung.

Priorität: 25.07.83 CH 4049/83

Veröffentlichungstag der Anmeldung:
27.03.85 Patentblatt 85/13

Bekanntmachung des Hinweises auf die Patenterteilung:
18.01.89 Patentblatt 89/3

Benannte Vertragsstaaten:
AT BE CH DE FR GB IT LI LU NL SE

Entgegenhaltungen:
EP-A-0 013 143
FR-M-7 324

Patentinhaber: **CIBA-GEIGY AG, Klybeckstrasse 141,**
CH-4002 Basel (CH)

Erfinder: **Hubele, Adolf, Dr., Obere Egg 9,**
CH-4312 Magden (CH)
Erfinder: **Zondler, Helmut, Dr., Oberwilerstrasse 49,**
CH-4103 Bottmingen (CH)
Erfinder: **Riebli, Peter, Bünthen 17, CH-4446 Buckten (CH)**
Erfinder: **Eckhardt, Wolfgang, Dr., Breslaustrasse 14,**
D-7850 Lörrach (DE)

EP 0 135 472 B1

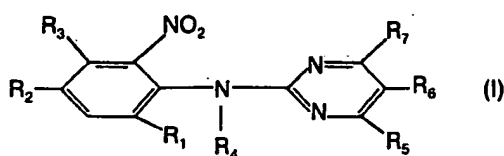
Anmerkung: Innerhalb von neun Monaten nach der Bekanntmachung des Hinweises auf die Erteilung des europäischen Patents im Europäischen Patentblatt kann jedermann beim Europäischen Patentamt gegen das erteilte europäische Patent Einspruch einlegen. Der Einspruch ist schriftlich einzureichen und zu begründen. Er gilt erst als eingelegt, wenn die Einspruchsgebühr entrichtet worden ist (Art. 99(1) Europäisches Patentübereinkommen).

Beschreibung

Die vorliegende Erfindung betrifft neue N(2-Nitrophenyl)-2-amino-pyrimidin-Derivate der nachstehenden Formel I.

Die Erfindung betrifft ferner die Herstellung dieser Substanzen sowie agrochemische Mittel, die als Wirkstoff mindestens eine dieser Verbindungen enthalten. Die Erfindung betrifft ebenso die Herstellung der genannten Mittel sowie die Verwendung der Wirkstoffe oder der Mittel zur Bekämpfung von schädlichen Mikroorganismen, vorzugsweise pflanzenschädigenden Pilzen und Bakterien.

Bei den erfindungsgemässen Verbindungen handelt es sich um solche der allgemeinen Formel I:



worin

R₁ und R₂ für Wasserstoff, NO₂ oder CF₃ stehen, mit der Massgabe, dass nur R₁ oder R₂ für NO₂ stehen kann;

R₃ Halogen bedeutet;

R₄ für Wasserstoff oder die Gruppe -C(O)R' steht, wobei R' unsubstituiertes oder durch Halogen, C₁-C₃-Alkoxy oder C₁-C₃-Alkylthio substituiertes C₁-C₄-Alkyl bedeutet;

R₅, R₆ und R₇ unabhängig voneinander für Wasserstoff, Halogen, Nitro, Cyano, Rhodano, C₁-C₁₂-Alkyl, C₃-C₈-Cycloalkyl, C₁-C₆-Alkylthio, C₁-C₆-Alkylsulfonyl, C₁-C₆-Alkylsulfoxy, C₃-C₆-Alkenyl, C₃-C₆-Haloalkenyl, C₃-C₆-Alkynyl, C₃-C₆-Haloalkynyl, C₃-C₆-Alkenyloxy, C₃-C₆-Haloalkenyloxy, C₃-C₆-Alkenylthio, C₃-C₆-Alkynyloxy, C₃-C₆-Haloalkynyloxy, durch Halogen, Cyano und/oder C₁-C₄-Alkoxy substituiertes C₁-C₆-Alkyl, unsubstituiertes oder durch Halogen substituiertes C₁-C₆-Alkoxy, dessen Alkylteil gegebenenfalls durch ein oder mehrere einzelne Sauerstoffatome unterbrochen ist oder für die Gruppe Q-(E)_n-(X)_m stehen, wobei n für 0 oder 1 steht, m für 0 oder 1 steht, Q für ein unsubstituiertes oder durch Halogen, Nitro, C₁-C₃-Alkyl, CF₃ und/oder C₁-C₃-Alkoxy substituiertes Phenyl oder einen gesättigten oder ungesättigten heterocyclischen Rest mit einem oder mehreren Heteroatomen steht, E eine C₁-C₃-Alkylenbrücke bedeutet und X für Sauerstoff oder Schwefel steht.

Unter dem Begriff Alkyl selbst oder als Bestandteil eines anderen Substituenten, wie Alkoxy, Haloalkyl, Haloalkoxy etc., sind je nach Zahl der angegebenen Kohlenstoffatome beispielsweise die folgenden geradkettigen oder verzweigten Gruppen zu verstehen: Methyl, Ethyl, Propyl, Butyl, Pentyl, Hexyl, Heptyl, Octyl, Nonyl, Decyl, Undecyl, Dodecyl usw. sowie ihre Isomeren, wie z.B. Isopropyl, Isobutyl, tert.-Butyl, Isopentyl usw. Die Vorsilbe Halo in der Bezeichnung eines Substi-

tuenten bedeutet hier und im folgenden, dass dieser Substituent einfach bis perhalogeniert auftreten kann. Halogen und Halo stehen stellvertretend für Fluor, Chlor, Brom oder Jod. Haloalkyl steht somit für einen einfach bis perhalogenierten Alkylrest, wie z.B. CHCl₂, CH₂F, CCl₃, CH₂Cl, CHF₂, CH₂CH₂Br, C₂Cl₅, CHBr, CHBrCl usw., vorzugsweise für CF₃. Alkenyl steht z.B. für Propenyl-(1), Allyl, Butenyl-(1), Butenyl-(2) oder Butenyl-(3) sowie Ketten mit mehreren Doppelbindungen. Cycloalkyl steht je nach Zahl der genannten Kohlenstoffatome z.B. für Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl, Cycloheptyl, Cyclooctyl usw. Alkynyl bedeutet z.B. Propinyl-(2), Propargyl, Butinyl-(1), Butinyl-(2) usw., vorzugsweise Propargyl.

Unter einem gesättigten oder ungesättigten heterocyclischen Rest mit einem oder mehreren Heteroatomen soll hier und im folgenden vorzugsweise ein gesättigter oder ungesättigter fünf- oder sechsgliedriger Heterocyclus verstanden werden mit ein bis drei gleichen oder verschiedenen Heteroatomen, wie z.B. Sauerstoff, Stickstoff oder Schwefel. Typische Vertreter derartiger Heterocyclen sind:

Tetrahydrofuran, Furan, Tetrahydrothiophen, Thiophen, Pyrrolidin, Pyrrol, Pyrrolin, Pyrazol, Imidazol, Pyrazolin, Oxazol, Thiazol, Isoxazol, Isothiazol, Pyran, Dihydropyran, Tetrahydropyran, Thiopyran, Dihydrothiopyran, Tetrahydrothiopyran, Pyridazin, Dihydropyridazin, Tetrahydropyridazin, Pyrimidin, Dihydropyrimidin, Tetrahydropyrimidin, Pyrazin, Dihydropyrazin, Tetrahydropyrazin, Morpholin, Thiazin, Dihydrothiazin, Tetrahydrothiazin, Piperazin und Triazin. C₁-C₃-Alkylen steht z.B. für folgende Gruppen: -CH₂-, -CH₂CH₂-, -CH₂CH₂CH₂-, -CH(CH₃)-CH₂-, -CH₂CH(CH₃)-, -CH(C₂H₅)-, -C(CH₃)₂-.

Verbindungen vom Phenylaminopyrimidin-Typ sind bereits verschiedentlich bekannt. So sind derartige Derivate beispielsweise beschrieben in der europäischen Patentanmeldung EP 013 143 als Herbizide, in der französischen Patentschrift FR-1 324 mit pharmakologischer, insbesondere antiphlogistischer Wirkung, und in J. Heterocyclic Chem. 10(2) 167-171 (1973) ohne Angabe biologischer Eigenschaften.

Die Verbindungen der Formel I sind bei Raumtemperatur Öle, Harze oder überwiegend kristalline Feststoffe, die sich durch sehr wertvolle biozide Eigenschaften auszeichnen. Sie lassen sich beispielsweise auf dem Agrarsektor oder verwandten Gebieten präventiv und kurativ zur Bekämpfung phytopathogener Schädlinge, wie z.B. Pilzen oder Bakterien, einsetzen. Die erfindungsgemässen Wirkstoffe der Formel I zeichnen sich in weiten Anwendungskonzentrationen durch eine hohe biozide Aktivität und grosse Wirkungsbreite aus und können problemlos insbesondere im Agrarbereich eingesetzt werden.

Folgende Wirkstoffgruppen sind aufgrund ihrer ausgeprägten bioziden, insbesondere pflanzenfungiziden Aktivität bevorzugt:

Gruppe Ia: Verbindungen der Formel I,

worin R_1 , R_2 , R_3 und R_4 die unter Formel I angegebenen Bedeutungen haben und R_5 , R_6 und R_7 unabhängig voneinander für Wasserstoff, Halogen, Nitro, Cyano, C_1 - C_6 -Alkyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl, C_1 - C_3 -Alkylthio, C_1 - C_3 -Alkylsulfonyl, C_1 - C_3 -Alkylsulfoxyl, C_3 - C_4 -Alkenyl, Propargyl, durch Halogen, Cyano und/oder C_1 - C_3 -Alkoxy substituiertes C_1 - C_3 -Alkyl, C_1 - C_6 -Alkoxy, dessen Alkylteil durch ein bis 2 einzelne Sauerstoffatome unterbrochen ist oder für die Gruppe $Q-(E)_n-(X)_m$ stehen, worin n für 0 oder 1 und m für 0 oder 1 steht, Q für ein unsubstituiertes oder durch Halogen, Nitro, Methyl, CF_3 oder Methoxy substituiertes Phenyl oder eine Pyridylgruppe steht, E für eine Methylenbrücke steht und X Sauerstoff oder Schwefel bedeutet.

Gruppe Ib: Verbindungen der Formel I,

worin R_1 , R_2 und R_3 die unter Formel I angegebenen Bedeutungen haben, R_4 für Wasserstoff steht und R_5 , R_6 und R_7 unabhängig voneinander für Wasserstoff, Halogen, Nitro, Cyano, C_1 - C_6 -Alkyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl, C_1 - C_3 -Alkylthio, C_1 - C_3 -Alkylsulfonyl, C_1 - C_3 -Alkylsulfoxyl, C_3 - C_4 -Alkenyl, Propargyl, durch Halogen, Cyano und/oder C_1 - C_3 -Alkoxy substituiertes C_1 - C_3 -Alkyl, C_1 - C_6 -Alkoxy, deren Alkylteil durch ein bis 2 einzelne Sauerstoffatome unterbrochen ist oder für die Gruppe $Q-(E)_n-(X)_m$ stehen, worin n für 0 oder 1 und m für 0 oder 1 steht, Q für ein unsubstituiertes oder durch Halogen, Nitro, Methyl, CF_3 oder Methoxy substituiertes Phenyl oder eine Pyridylgruppe steht, E für eine Methylenbrücke steht und X Sauerstoff oder Schwefel bedeutet.

Gruppe Ic: Verbindungen der Formel I,

worin R_1 für NO_2 oder CF_3 steht; R_2 für NO_2 oder CF_3 steht; mit der Massgabe, dass nur R_1 oder R_2 NO_2 sein kann; R_3 Chlor bedeutet; R_4 für Wasserstoff steht; R_5 Wasserstoff bedeutet und R_6 und R_7 unabhängig voneinander für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, C_1 - C_3 -Alkyl, C_1 - C_3 -Haloalkyl, C_1 - C_3 -Alkoxy, C_1 - C_3 -Haloalkoxy, unsubstituiertes oder durch Halogen substituiertes Phenoxy, OCH_2 , OCH_3 , $OC_2H_4OCH_3$, $OCH_2OC_2H_5$, $OC_2H_4OC_2H_5$, $OC_2H_4OC_2H_4OC_2H_5$ oder $-S-(2-Pyridyl)$ stehen.

Gruppe Id: Verbindungen der Formel I,

worin R_1 für NO_2 oder CF_3 steht; R_2 für NO_2 oder CF_3 steht; mit der Massgabe, dass nur R_1 oder R_2 NO_2 sein kann; R_3 Halogen bedeutet; R_4 für Wasserstoff oder die Gruppe $-C(O)R'$ steht, wobei R' unsubstituiertes oder durch Halogen, C_1 - C_3 -Alkoxy oder C_1 - C_3 -Alkylthio substituiertes C_1 - C_4 -Alkyl bedeutet; R_5 , R_6 und R_7 unabhängig voneinander für Wasserstoff, Halogen, Nitro, Cyano, Rhodano, C_1 - C_{12} -Alkyl, C_3 - C_6 -Cycloalkyl, C_1 - C_6 -Alkylthio, C_1 - C_6 -Alkylsulfonyl, C_1 - C_6 -Alkylsulfoxyl, C_3 - C_6 -Alkenyl, C_3 - C_6 -Haloalkenyl, C_3 - C_6 -Alkinyl, C_3 - C_6 -Haloalkinyl, durch Halogen, Cyano und/oder C_1 - C_4 -Alkoxy substituiertes C_1 - C_6 -Alkyl, unsubstituiertes oder durch Halogen substituiertes C_1 - C_6 -Alkoxy, dessen Alkylteil gegebenenfalls durch ein oder mehrere einzelne Sauerstoffatome unterbro-

chen ist oder für die Gruppe $Q-(E)_n-(X)_m$ stehen, wobei n für 0 oder 1 steht, m für 0 oder 1 steht, Q für ein unsubstituiertes oder durch Halogen, Nitro, C_1 - C_3 -Alkyl, CF_3 und/oder C_1 - C_3 -Alkoxy substituiertes Phenyl oder einen gesättigten oder ungesättigten heterocyclischen Rest mit einem oder mehreren Heteroatomen steht, E eine C_1 - C_3 -Alkylenbrücke bedeutet und X für Sauerstoff oder Schwefel steht.

Besonders bevorzugte Einzelsubstanzen sind z.B.:

N-(3'-Chlor-2',6'-dinitro-4'-trifluormethylphenyl)-2-amino-4,6-dichlorpyrimidin (Verb. Nr. 1.1),

N-(3'-Chlor-2',6'-dinitro-4'-trifluormethylphenyl)-2-amino-4-chlor-6-trichlormethylpyrimidin (1.11),

N-(3'-Chlor-2',6'-dinitro-4'-trifluormethylphenyl)-2-amino-4,6-dimethylpyrimidin (1.15),

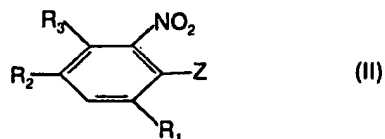
N-(3'-Chlor-2',6'-dinitro-4'-trifluormethylphenyl)-2-amino-4-trichlormethyl-6-(methoxyethoxy)pyrimidin (1.6),

N-(3'-Chlor-2',6'-dinitro-4'-trifluormethylphenyl)-2-amino-4-methoxy-6-(2-pyridylthio)pyrimidin (1.2),

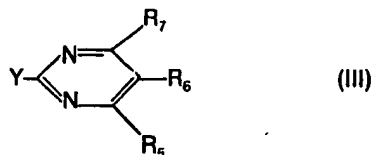
N-(3'-Chlor-2',6'-dinitro-4'-trifluormethylphenyl)-2-amino-4-trichlormethyl-6-(ethoxyethoxyethoxy)pyrimidin (1.4),

N-(3'-Chlor-2',6'-dinitro-4'-trifluormethylphenyl)-2-amino-4-methoxy-6-(4'-chlorphenoxy)pyrimidin (1.8).

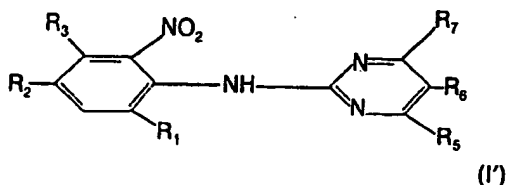
Die Verbindungen der Formel I werden erfindungsgemäss dadurch hergestellt, dass man eine Verbindung der Formel II



In Gegenwart einer Base mit einem Pyrimidin-Derivat der Formel III



zu einer Verbindung der Formel I'



umsetzt, und letztere zur Herstellung N-acylierter Derivate mit einem reaktionsfähigen Derivat der Carbonsäure IV



N-acyliert, wobei die Substituenten R_1 bis R_7 die unter Formel I angegebenen Bedeutungen haben

und Z und Y für NH_2 oder Halogen stehen, wobei in dem Fall, in dem Z für Halogen steht, Y NH_2 bedeutet und in dem Fall in dem Z für NH_2 steht, Y Halogen bedeutet.

Für die Herstellung der Verbindungen der Formel I bzw. I' sind folgende Reaktionsbedingungen vorteilhaft:

Die N-Alkylierung von (II) mit (III) zu (I'), sowie die N-Acylierung von (I') mit (IV) zu (I) erfolgen unter Halogenwasserstoffabspaltung. Die Reaktionstemperaturen liegen bei der N-Alkylierung zwischen -20° und 150°C , vorzugsweise -20° und $+30^\circ\text{C}$, bei der N-Acylierung zwischen 0° und $+180^\circ\text{C}$, vorzugsweise 0° und 150°C bzw. am Siedepunkt des Lösungsmittels bzw. Lösungsmittelgemisches. In beiden Fällen ist die Verwendung von säurebindenden Mitteln bzw. Kondensationsmitteln vorteilhaft. Als solche kommen organische und anorganische Basen in Betracht, z. B. tertiäre Amine wie Trialkylamine (Trimethylamin, Triethylamin, Tripropylamin usw.), Pyridin und Pyridinbasen (4-Dimethylaminopyridin, 4-Pyrrolidylaminopyridin usw.), Oxide und Hydroxide, Carbonate und Hydrogencarbonate von Alkali- und Erdalkalimetallen sowie Alkaliacetate.

Entstehender Halogenwasserstoff kann in manchen Fällen auch mittels Durchleiten von Inertgas, z. B. Stickstoff aus dem Reaktionsgemisch vertrieben werden.

Die Reaktionen können in Anwesenheit von reaktionsinerten Lösungs- oder Verdünnungsmitteln durchgeführt werden. In Frage kommen beispielsweise aliphatische und aromatische Kohlenwasserstoffe wie Benzol, Toluol, Xylole, Petrolether; halogenierte Kohlenwasserstoffe wie Chlorbenzol, Methylenchlorid, Ethylenchlorid, Chloroform, Tetrachlorkohlenstoff, Tetrachlorethylen; Ether und etherartige Verbindungen wie Dialkylether (Diethylether, Diisopropylether, tert.-Butylmethylether usw.), Anisol, Dioxan, Tetrahydrofuran; Nitrile wie Acetonitril, Propionitril; N,N-dialkylierte Amide wie Dimethylformamid; Dimethylsulfoxid; Ketone wie Aceton, Diethylketon, Methyläthylketon und Gemische solcher Lösungsmittel untereinander. In manchen Fällen kann das Acylierungs- oder Alkylierungsmittel selbst als Lösungsmittel dienen.

Die Gegenwart eines Reaktionskatalysators wie Dimethylformamid kann von Vorteil sein.

Die Reaktion (II) und (III) kann auch in einem wässrigen Zweiphasensystem nach dem allgemein bekannten Prinzip der Phasentransferkatalyse durchgeführt werden.

Für die organische, mit Wasser nicht mischbare Phase kommen dabei z. B. folgende Lösungsmittel in Frage: Aliphatische und aromatische Kohlenwasserstoffe, wie Pentan, Hexan, Cyclohexan, Petrolether, Ligroin, Benzol, Toluol, Xylole usw., halogenierte Kohlenwasserstoffe, wie Dichlormethan, Chloroform, Tetrachlorkohlenstoff, Ethylenchlorid, 1,2-Dichlorethan, Tetrachlorethylen usw. oder aliphatische Ether, wie Diethylether, Diisopropylether, t-Butylmethylether usw. Beispiele geeigneter Phasentransfer-Katalysatoren sind: Tetraalkylammoniumhalogenide, -hydrogen-

sulfate oder -hydroxide wie Tetrabutylammoniumchlorid, -bromid, -jodid; Triethylbenzylammoniumchlorid, -bromid; Tetrapropylammoniumchlorid, -bromid, -jodid; usw. Als Phasentransfer-Katalysatoren kommen auch Phosphonium-Salze in Betracht. Die Reaktionstemperaturen liegen im allgemeinen zwischen -30° und 130°C , bzw. am Siedepunkt des Lösungsmittels oder Lösungsmittelgemisches.

Im übrigen kann bei der Herstellung aller hierin genannten Ausgang-, Zwischen- und Endprodukte können grundsätzlich, sofern nicht ausdrücklich im einzelnen spezifiziert, ein oder mehrere reaktionsinerte Lösungs- oder Verdünnungsmittel anwesend sein. In Frage kommen beispielsweise aliphatische und aromatische Kohlenwasserstoffe wie Benzol, Toluol, Xylole, Petrolether; halogenierte Kohlenwasserstoffe wie Chlorbenzol, Methylenchlorid, Ethylenchlorid, Chloroform, Tetrachlorkohlenstoff, Tetrachlorethylen; Ether und etherartige Verbindungen wie Dialkylether (Diethylether, Diisopropylether, tert.-Butylmethylether usw.), Anisol, Dioxan, Tetrahydrofuran; Nitrile wie Acetonitril, Propionitril; N,N-dialkylierte Amide wie Dimethylformamid; Dimethylsulfoxid; Ketone wie Aceton, Diethylketon, Methyläthylketon und Gemische solcher Lösungsmittel untereinander. In manchen Fällen kann es auch von Vorteil sein, wenn die Reaktion oder Teilschritte einer Reaktion unter Schutzgasatmosphäre und/oder absoluten Lösungsmitteln durchgeführt werden. Als Schutzgase eignen sich inerte Gase wie Stickstoff, Helium, Argon oder in gewissen Fällen auch Kohlendioxid.

Das beschriebene Herstellungsverfahren ist, einschliesslich aller Teilschritte, ein wichtiger Bestandteil der vorliegenden Erfindung.

Es wurde überraschend festgestellt, dass Verbindungen der Formel I ein für praktische Bedürfnisse sehr günstiges biozides Spektrum gegen Pilze und Bakterien insbesondere gegen phytopathogene Pilze und Bakterien aufweisen. Sie besitzen sehr vorteilhafte kurative, systemische und insbesondere präventive Eigenschaften und lassen sich zum Schutz von zahlreichen Kulturpflanzen einsetzen. Mit den Wirkstoffen der Formel I können an Pflanzen oder an Pflanzenteilen (Früchte, Blüten, Laubwerk, Stengel, Knollen, Wurzeln) von unterschiedlichen Nutzkulturen die auftretenden Schädlinge eingedämmt oder vernichtet werden, wobei auch später zuwachsende Pflanzenteile vor phytopathogenen Mikroorganismen und Insekten verschont bleiben. Ferner können Akarina und unerwünschte Pflanzenarten erfolgreich mit den Wirkstoffen der Formel I bekämpft werden.

Als Mikrobizide sind die Wirkstoffe der Formel I z. B. gegen die den folgenden Klassen angehörenden phytopathogenen Pilze wirksam: Fungi imperfecti (z. B. Botrytis, Helminthosporium, Fusarium, Septoria, Cercospora und Alternaria); Basidiomyceten (z. B. die Gattungen Hemileia, Rhizocotonia, Puccinia); insbesondere wirken sie gegen die Klasse der Ascomyceten (z. B. Venturia, Podosphaera, Erysiphe, Monilinia, Uncinula). Überdies

wirken die Verbindungen der Formel I systemisch. Sie können ferner als Beizmittel zur Behandlung von Saatgut (Früchte, Knollen, Körner) und Pflanzenstecklingen zum Schutz von Pilzinfektionen sowie gegen im Erdboden auftretende phytopathogene Pilze eingesetzt werden.

Die Erfindung betrifft somit auch Schädlingsbekämpfungsmittel sowie deren Verwendung auf den Agrarsektor oder verwandten Gebieten.

Darüberhinaus schliesst die vorliegende Erfindung auch die Herstellung dieser Mittel ein, die gekennzeichnet ist durch das innige Vermischen der Aktivsubstanz mit einem oder mehreren hierin beschriebenen Substanzen bzw. Substanzgruppen. Eingeschlossen ist auch ein Verfahren zur Behandlung von Pflanzen, das sich durch Applikation der Verbindungen der Formel I bzw. der neuen Mittel auszeichnet.

Als Zielkulturen für den hierin offenbarten mikrobiziden Einsatz gelten im Rahmen dieser Erfindung beispielsweise folgende Pflanzenarten: Getreide: (Weizen, Gerste, Roggen, Hafer, Reis, Sorghum und Verwandte); Rüben: (Zucker- und Futterrüben); Kern-, Stein- und Beerenobst: (Äpfel, Birnen, Pflaumen, Pfirsiche, Mandeln, Kirschen, Erd-, Him- und Brombeeren); Hülsenfrüchte: (Bohnen, Linsen, Erbsen, Soja); Ölkulturen: (Raps, Senf, Mohn, Oliven, Sonnenblumen, Kokos, Rizinus, Kakao, Erdnüsse); Gurkengewächse: (Kürbis, Gurken, Melonen); Fasergewächse: (Baumwolle, Flachs, Hanf, Jute); Citrusfrüchte: (Orangen, Zitronen, Pampelmusen, Mandarinen); Gemüsesorten: (Spinat, Kopfsalat, Spargel, Kohlartern, Möhren, Zwiebeln, Tomaten, Kartoffeln, Paprika); Lorbeergewächse: (Avocado, Cinnamonum, Kampfer) oder Pflanzen wie Mals, Tabak, Nüsse, Kaffee, Zuckerrohr, Tee, Weinreben, Hopfen, Bananen- und Naturkautschukgewächse sowie Zierpflanzen (Compositen).

Wirkstoffe der Formel I werden üblicherweise in Form von Zusammensetzungen verwendet und können gleichzeitig oder nacheinander mit weiteren Wirkstoffen auf die zu behandelnde Fläche oder Pflanze gegeben werden. Diese weiteren Wirkstoffe können sowohl Düngemittel, Spurenelement-Vermittler oder andere das Pflanzenwachstum beeinflussende Präparate sein. Es können aber auch selektive Herbizide, Insektizide, Fungizide, Bakterizide, Nematizide, Molluskizide oder Gemische mehrerer dieser Präparate sein, zusammen mit gegebenenfalls weiteren in der Formulierungstechnik üblichen Trägerstoffen, Tensiden oder anderen applikationsfördernden Zusätzen.

Geeignete Träger und Zusätze können fest oder flüssig sein und entsprechen den in der Formulierungstechnik zweckdienlichen Stoffen, wie z.B. natürlichen oder regenerierten mineralischen Stoffen, Lösungs-, Dispergier-, Netz-, Haft-, Verdickungs-, Binde- oder Düngemitteln.

Ein bevorzugtes Verfahren zum Aufbringen eines Wirkstoffes der Formel I bzw. eines agrochemischen Mittels, das mindestens einen dieser Wirkstoffe enthält, ist das Aufbringen auf das Blattwerk (Blattapplikation). Anzahl der Applikationen

und Aufwandmenge richten sich dabei nach dem Befallsdruck für den entsprechenden Erreger (Pilzsorte). Die Wirkstoffe der Formel I können aber auch über den Erdboden durch das Wurzelwerk in die Pflanze gelangen (systemische Wirkung), indem man den Standort der Pflanze mit einer flüssigen Zubereitung trinkt oder die Substanzen in fester Form in den Boden einbringt, z.B. in Form von Granulat (Bodenapplikation). Die Verbindungen der Formel I können aber auch auf Samenkörner aufgebracht werden (Coating), indem man die Körner entweder mit einer flüssigen Zubereitung des Wirkstoffs trinkt oder sie mit einer festen Zubereitung beschichtet. Darüberhinaus sind in besonderen Fällen weitere Applikationsarten möglich, so z.B. die gezielte Behandlung der Pflanzenstengel oder der Knospen.

Die Verbindungen der Formel I werden dabei in unveränderter Form oder vorzugsweise zusammen mit den in der Formulierungstechnik üblichen Hilfsmitteln eingesetzt und werden daher z.B. zu Emulsionskonzentraten, streichfähigen Pasten, direkt versprühbaren oder verdünnbaren Lösungen, verdünnten Emulsionen, Spritzpulvern, löslichen Pulvern, Stäubemitteln, Granulaten, durch Verkapselungen in z.B. polymeren Stoffen in bekannter Weise verarbeitet. Die Anwendungsverfahren wie Versprühen, Vernebeln, Verstäuben, Verstreuen, Bestreichen oder Giessen werden gleich wie die Art der Mittel den angestrebten Zielen und den gegebenen Verhältnissen entsprechend gewählt. Günstige Aufwandmengen liegen im allgemeinen bei 50 g bis 5 kg Aktivsubstanz (AS) je ha; bevorzugt 100 g bis 2 kg AS/ha, insbesondere bei 200 g bis 600 g AS/ha.

Die Formulierungen d.h. die den Wirkstoff der Formel I und gegebenenfalls einen festen oder flüssigen Zusatzstoff enthaltenden Mittel, Zubereitungen oder Zusammensetzungen werden in bekannter Weise hergestellt, z.B. durch inniges Vermischen und/oder Vermahlen der Wirkstoffe mit Streckmitteln, wie z.B. mit Lösungsmitteln, festen Trägerstoffen, und gegebenenfalls oberflächenaktiven Verbindungen (Tensiden).

Als Lösungsmittel können in Frage kommen: Aromatische Kohlenwasserstoffe, bevorzugt die Fraktionen C₈ bis C₁₂, wie z.B. Xylolgemische oder substituierte Naphthaline, Phthalsäureester wie Dibutyl- oder Dioctylphthalat, aliphatische Kohlenwasserstoffe wie Cyclohexan oder Paraffine, Alkohole und Glykole sowie deren Ether und Ester, wie Ethanol, Ethylenglykol, Ethylenglykolmonomethyl- oder Ethylether, Ketone wie Cyclohexanon, stark polare Lösungsmittel wie N-Methyl-2-pyrrolidon, Dimethylsulfoxid oder Dimethylformamid, sowie gegebenenfalls epoxydierte Pflanzenöle wie epoxydiertes Kokosnussöl oder Sojaöl; oder Wasser.

Als feste Trägerstoffe, z.B. für Stäubemittel und dispergierbare Pulver, werden in der Regel natürliche Gesteinsmehle verwendet, wie Calcit, Talkum, Kaolin, Montmorillonit oder Attapulgit. Zur Verbesserung der physikalischen Eigenschaften können auch hochdisperse Kieselsäure oder hochdisperse saugfähige Polymerisate zugesetzt

werden. Als gekörnte, adsorptive Granulatträger kommen poröse Typen wie z. B. Bimsstein, Ziegelbruch, Sepiolit oder Bentonit, als nicht sorptive Trägermaterialien z. B. Calcit oder Sand in Frage. Darüberhinaus kann eine Vielzahl von vorgranulierten Materialien anorganischer oder organischer Natur wie insbesondere Dolomit oder zerkleinerte Pflanzenrückstände verwendet werden. Besonders vorteilhafte, applikationsfördernde Zuschlagstoffe, die zu einer starken Reduktion der Aufwandmenge führen können, sind ferner natürliche (tierische oder pflanzliche) oder synthetische Phospholipide aus der Reihe der Kepheline und Lecithine, wie z. B.

Phosphatidylethanolamin, Phosphatidylserin, Phosphatidylcholin, Sphingomyelin, Phosphatidylinosit, Phosphatidylglycerin, Lysolecithin, Plasmalogene oder Cardiolipin, die man beispielsweise aus tierischen oder pflanzlichen Zellen, insbesondere aus Hirn, Herz, Leber, Eidotter oder Sojabohnen gewinnen kann. Verwendbare Handelsmischungen sind z. B. Phosphatidylcholin-Mischungen. Synthetische Phospholipide sind z. B. Dioctanoylphosphatidylcholin und Dipalmitoylphosphatidylcholin.

Als oberflächenaktive Verbindungen kommen je nach Art des zu formulierenden Wirkstoffes der Formel I nichtionogene, kation- und/oder anionaktive Tenside mit guten Emulgier-, Dispergier- und Netzeigenschaften in Betracht. Unter Tensiden sind auch Tensidgemische zu verstehen.

Geeignete anionische Tenside können sowohl sog. wasserlösliche Seifen, als auch wasserlösliche synthetische oberflächenaktive Verbindungen sein.

Als Seifen seien die Alkali-, Erdalkali- oder gegebenenfalls substituierten Ammoniumsalze von höheren Fettsäuren (C_{10} – C_{22}), wie z. B. die Na- oder K-Salze der Öl- oder Stearinsäure, oder von natürlichen Fettsäuregemischen, die z. B. aus Kokosnuss- oder Talgöl gewonnen werden können. Ferner sind auch die Fettsäure-methylaurinsalze zu erwähnen.

Häufiger werden jedoch sog. synthetische Tenside verwendet, insbesondere Fettsulfonate, Fettsulfate, sulfonierte Benzimidazol-derivate oder Alkylsulfonate.

Die Fettsulfonate oder -sulfate liegen in der Regel als Alkali-, Erdalkali- oder gegebenenfalls substituierte Ammoniumsalze vor und weisen einen Alkalirest mit 8 bis 22 C-Atomen auf, wobei Alkyl auch den Alkylteil von Acylresten einschließt, z. B. das Na- oder Ca-Salz der Ligninsulfonsäure, des Dodecylschwefelsäureesters oder eines aus natürlichen Fettsäuren hergestellten Fettalkoholsulfatgemisches. Hierher gehören auch die Salze der Schwefelsäureester und Sulfonsäuren von Fettalkohol-Ethylenoxyd-Addukten. Die sulfonierten Benzimidazol-derivate enthalten vorzugsweise 2-Sulfonsäuregruppen und einen Fettsäurerest mit 8–22 C-Atomen. Alkylarylsulfonate sind z. B. die Na-, Ca- oder Triethanolamin-salze der Dodecylbenzolsulfonsäure, der Dibutyl-naphthalinsulfonsäure, oder eines Naphthalinsulfonsäure-Formaldehydkondensationsproduktes.

Ferner kommen auch entsprechende Phosphate wie z. B. Salze des Phosphorsäureesters eines p-Nonylphenol-(4-14)-Ethylenoxyd-Adduktes in Frage.

Als nichtionische Tenside kommen in erster Linie Polyglykoetherderivate von aliphatischen oder cycloaliphatischen Alkoholen, gesättigten oder ungesättigten Fettsäuren und Alkylphenolen in Frage, die 3 bis 30 Glykoethergruppen und 8 bis 20 Kohlenstoffatome im (aliphatischen) Kohlenwasserstoffrest und 6 bis 18 Kohlenstoffatome im Alkylrest der Alkylphenole enthalten können.

Weitere geeignete nichtionische Tenside sind die wasserlöslichen, 20 bis 250 Äthylenglykol-äthergruppen und 10 bis 100 g Propylenglykol-äthergruppen enthaltenden Polyethylenoxydaddukte an Polypropylenglykol, Äthylendiaminopolypropylenglykol und Alkylpolypropylenglykol mit 1 bis 10 Kohlenstoffatomen in der Alkylkette. Die genannten Verbindungen enthalten üblicherweise pro Propylenglykol-Einheit 1 bis 5 Ethylenglykoleinheiten.

Als Beispiele nichtionischer Tenside seien Nonylphenolpolyethoxyethanole, Ricinusölpolyglykoether, Polypropylen-Polyethylenoxydaddukte, Tributylphenoxypolyethylenethanol, Polyethylen-glykol und Octylphenoxypolyethoxyethanol erwähnt.

Ferner kommen auch Fettsäureester von Polyoxyethylensorbitan wie das Polyoxyethylensorbitan-trioleat in Betracht.

Bei den kationischen Tensiden handelt es sich vor allem um quartäre Ammoniumsalze, welche als N-Substituenten mindestens einen Alkylrest mit 8 bis 22 C-Atomen enthalten und als weitere Substituenten niedrige, gegebenenfalls halogenierte Alkyl-, Benzyl- oder niedrige Hydroxyalkylreste aufweisen. Die Salze liegen vorzugsweise als Halogenide, Methylsulfate oder Ethylsulfate vor, z. B. das Stearyltrimethylammoniumchlorid oder das Benzyl-di(2-chlorethyl)ethylammoniumbromid.

Die in der Formulierungstechnik gebräuchlichen Tenside sind u. a. in folgenden Publikationen beschrieben:

«Mc Cutcheon's Detergents and Emulsifiers Annual» BC Publishing Corp., Ringwood New Jersey, 1981;

Helmut Stache «Tensid-Taschenbuch» Carl Hanser-Verlag München/Wien 1981.

Die agrochemischen Zubereitungen enthalten in der Regel 0,1 bis 99%, insbesondere 0,1 bis 95% Wirkstoff der Formel I, 99,9 bis 1%, insbesondere 99,8 bis 5% eines festen oder flüssigen Zusatzstoffes und 0 bis 25%, insbesondere 0,1 bis 25% eines Tensides.

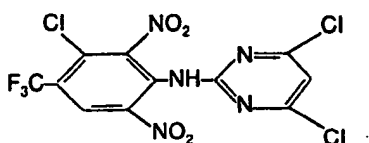
Während als Handelsware eher konzentrierte Mittel bevorzugt werden, verwendet der Endverbraucher in der Regel verdünnte Mittel.

Die Mittel können auch weitere Zusätze wie Stabilisatoren, Entschäumer, Viskositätsregulatoren, Bindemittel, Haftmittel sowie Dünger oder andere Wirkstoffe zur Erzielung spezieller Effekte enthalten.

Derartige agrochemische Mittel sind ein Bestandteil der vorliegenden Erfindung.

Die nachfolgenden Beispiele dienen zur näheren Erläuterung der Erfindung. Temperaturen sind in Celsiusgraden angegeben. Prozente und Teile beziehen sich auf das Gewicht. Darüberhinaus werden folgende Symbole verwendet: h = Stunde; d = Tag; min = Minute; RT = Raumtemperatur; N = Normalität; abs = absolut, wasserfrei; DMSO = Dimethylsulfoxid; DMF = Dimethylformamid. Druckangaben erfolgen in Millibar mb, oder Bar b.

Beispiel H1: Herstellung von



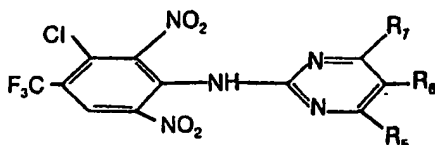
(Verb. Nr. 1.1)

N-(3'-Chlor-2',6'-dinitro-4'-trifluormethylphenyl)-2-amino-4,6-dichlorpyrimidin

Eine Lösung von 15 Teilen 4,6-Dichlor-2-aminopyrimidin in 400 ml Tetrahydrofuran wird bei Raumtemperatur unter Rühren portionsweise mit 13,2 Teilen 85%igen, pulverisiertem Kaliumhydroxid versetzt, wobei die Temperatur innerhalb einer halben Stunde auf 23° ansteigt. Das Reaktionsgemisch wird auf 5° abgekühlt, und zu der beigen Suspension werden innerhalb von 1 Stunde 28 Teile 2,4-Dichlor-3,5-dinitro-benzotrifluorid in 80 ml Tetrahydrofuran zugetropft, wobei sich die Suspension rot verfärbt. Nach 15 stündigem Rühren bei Raumtemperatur wird das Reaktionsgemisch auf Eiswasser gegossen, mit 10 ml konzentrierter Salzsäure angesäuert und zweimal mit je 200 ml Essigsäureethylester extrahiert. Die vereinigten Extrakte werden zweimal mit je 100 ml Wasser gewaschen, über Natriumsulfat getrocknet, filtriert und eingedampft. Die zurückbleibende Kristallmasse wird aus 400 ml Isopropanol umkristallisiert; gelbe Kristalle mit Smp. 199–200°.

Analog den vorstehend beschriebenen Arbeitsweisen werden auch die nachfolgend aufgezählten Verbindungen der Formel I hergestellt:

Tabelle 1: Verbindungen der Formel



Verb. Nr.	R ₅	R ₆	R ₇	physikalische Konstante [°C]
1.1	Cl	H	Cl	Smp. 198–200
1.2	OCH ₃	H	-S-(2-Pyridyl)	Smp. 67–70
1.3	H	H	H	Smp. 189–191
1.4	CCl ₃	H	-OC ₂ H ₄ OC ₂ H ₄ OC ₂ H ₅	Smp. 54–59
1.5	CH ₃	H	Cl	Smp. 172–174
1.6	CCl ₃	H	-OC ₂ H ₄ OCH ₃	Smp. 130–133
1.7	CH ₃	H	OCH ₃	Smp. 209–210 Zers.
1.8	OCH ₃	H	-O-[C ₆ H ₄ Cl(4)]	Smp. 53–58
1.9	Cl	H	OCH ₃	Smp. 180–181
1.10	OCH ₃	H	-O-[C ₆ H ₄ Cl(4)]	Smp. 133–137
1.11	Cl	H	CCl ₃	Smp. 161–163
1.12	CCl ₃	H	-S-(2-Pyridyl)	Smp. 189–192,5
1.13	OCH ₃	H	CH ₂ OCH ₃	Smp. 103–106
1.14	CH ₃	H	OCHF ₂	Smp. 147–148
1.15	CH ₃	H	CH ₃	Smp. 155–156
1.16	OCH ₃	H	OCH ₃	Smp. 169–171
1.17	OCH ₃	H	SC ₄ H ₉ -n	Smp. 103–104
1.18	CH ₃	H	H	Smp. 164–165
1.19	CF ₃	CH ₃	H	Smp. 126–129
1.20	CF ₃	H	CH ₃	Smp. 145–147
1.21	SCH ₃	CN	H	
1.22	OCH ₃	CN	H	Smp. 152–158
1.23	C ₂ H ₅	H	H	
1.24	H	OC ₄ H ₉ -I	H	
1.25	OCH ₂ OCH ₃	H	OCH ₂ OCH ₃	
1.26	Cl	J	H	
1.27	J	H	J	

Tabelle 1: (Fortsetzung)

Verb. Nr.	R ₅	R ₆	R ₇	physikalische Konstante [°C]
1.28	CH ₃	CN	SO ₂ CH ₃	ab 87° Zers.
1.29	OCH ₃	J	CH ₂ F	
1.30	C ₆ H ₅	H	H	
1.31	H	OCH ₃	H	Smp. 118-120
1.32	OC ₂ H ₅	H	CH ₂ F	
1.33	CH ₃	NO ₂	SO ₂ CH ₃	
1.34	C ₄ H ₉ -n	NO ₂	H	
1.35	OCH ₃	H	OC ₂ H ₅	
1.36	CH ₃	H	C ₃ H ₇ -n	
1.37	Br	H	H	
1.38	Cl	F	H	
1.39	Cl	H	S(O)CH ₃	
1.40	H	O-C ₆ H ₅	H	
1.41	Cl	H	C ₆ H ₁₃ -n	
1.42	H	OC ₃ H ₇ -n	H	
1.43	OC ₂ H ₅	H	H	Smp. 104-106
1.44	OCH ₃	H	CH ₂ OC ₂ H ₅	
1.45	OC ₄ H ₉ -n	H	OC ₄ H ₉ -n	
1.46	Cl	H	SO ₂ CH ₃	
1.47	Cl	OCH ₃	H	
1.48	SC ₂ H ₅	H	SC ₂ H ₅	
1.49	CH ₃	H	SC ₆ H ₅	
1.50	CH ₂ OCH ₃	H	H	
1.51	OCH ₃	NO ₂	H	
1.52	Cl	H	CH ₂ Cl	Harz
1.53	Cl	OC ₆ H ₅	H	Smp. 211-212
1.54	Cl	CN	OCH ₃	
1.55	OCH ₃	Cl	H	
1.56	Cl	S(O)CH ₃	H	
1.57	H	SCH ₂ -C ₆ H ₅	H	
1.58	C ₆ H ₅	CH ₃	H	
1.59	SCH ₃	H	H	
1.60	OC ₂ H ₅	NO ₂	H	
1.61	H	CH ₂ -C ₆ H ₅	H	
1.62	Cl	H	C ₂ H ₅	Smp. 147-148
1.63	OCH ₃	H	CH ₂ F	Smp. 111-112
1.64	Cl	H	OC ₂ H ₅	
1.65	CH ₂ OC ₂ H ₅	OC ₂ H ₅	H	
1.66	H	SCH ₃	H	
1.67	OCH ₃	J	H	
1.68	Cl	SO ₂ CH ₃	H	
1.69	OCH ₃	F	H	
1.70	Cl	H	SCN	Smp. 147-148
1.71	C ₂ H ₅	H	Cl	
1.72	Cl	OC ₂ H ₅	H	
1.73	SO ₂ C ₂ H ₅	H	H	Smp. 97-98
1.74	Cl	H	CH ₂ OCH ₃	
1.75	Cl	H	OCH ₂ CH=CH ₂	
1.76	Cl	NO ₂	CH ₃	
1.77	H	C ₆ H ₅	H	
1.78	CH ₃	NO ₂	CH ₃	
1.79	CH ₃	C ₂ H ₅	H	
1.80	Br	H	CH ₃	
1.81	CCl ₃	H	CCl ₃	
1.82	H	Cl	H	
1.83	CH ₃	Br	H	
1.84	OC ₄ H ₉ -n	H	CH ₃	
1.85	Cl	CH ₃	H	semikristallin
1.86	CH ₃	Cl	H	
1.87	H	NO ₂	H	
1.88	Cl	Br	Cl	semikristallin

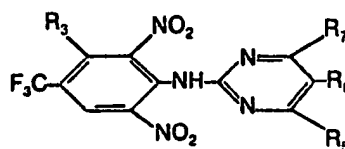
Tabelle 1: (Fortsetzung)

Verb. Nr.	R ₅	R ₆	R ₇	physikalische Konstante [°C]
1.89	OCH ₂ -C ₆ H ₅	H	F	
1.90	Cl	H	OC ₃ H ₇ -i	
1.91	CH ₃	Cl	CH ₃	
1.92	H	S-C ₆ H ₅	H	
1.93	CH ₂ Br	Br	CH ₂ Br	
1.94	C ₂ H ₅	CH ₃	H	
1.95	CH ₃	CN	H	
1.96	F	H	F	
1.97	H	F	H	
1.98	Cl	CH ₂ -C ₆ H ₅	H	
1.99	C ₆ H ₅	CN	H	
1.100	Cl	CH ₂ C ₆ H ₅	Cl	
1.101	Cl	SCH ₃	H	
1.102	Cl	C ₆ H ₅	Cl	
1.103	CH ₃	NO ₂	SCH ₃	
1.104	Cl	CH ₂ CH ₂ Cl	CH ₃	
1.105	CH ₃	Br	C ₆ H ₅	
1.106	Cl	C ₂ H ₅	Cl	
1.107	Cl	Br	CH ₃	
1.108	CH ₃	J	CH ₃	
1.109	Cl	CH ₃	CH ₃	
1.110	CH ₃	Br	CH ₃	
1.111	Cl	C ₂ H ₅	CH ₃	
1.112	Cl	CH ₃	Cl	
1.113	Cl	C ₄ H ₉ -n	Cl	
1.114	Cl	H	OCH ₂ C≡CH	Smp. 129-130
1.115	Cl	CH ₂ C≡CH	C ₆ H ₅	
1.116	OCH ₃	CH ₃	CH ₃	
1.117	Cl	CH ₂ CH ₂ CN	CH ₃	
1.118	Cl	OCH ₃	CH ₂ OCH ₃	
1.119	Cl	Cl	CH ₃	
1.120	OCH ₃	C ₂ H ₅	OCH ₃	
1.121	CH ₃	Br	C ₃ H ₇ -n	
1.122	Cl	OC ₂ H ₅	Cl	
1.123	OCH ₃	OCH ₃	CH ₃	
1.124	OC ₂ H ₅	OC ₂ H ₅	OC ₂ H ₅	
1.125	CH ₃	CN	SCH ₃	
1.126	Cl	CN	CH ₃	
1.127	CH ₃	Br	SCH ₃	
1.128	Cl	C ₆ H ₄ Cl(4)	Cl	
1.129	Cl	OC ₂ H ₅	CH ₂ OC ₂ H ₅	
1.130	CH ₃	Br	OC ₆ H ₅	
1.131	OCH ₃	CH ₃	OCH ₃	
1.132	SCH ₃	C ₆ H ₅	SCH ₃	
1.133	Cl	OCH ₃	Cl	
1.134	OCH ₃	OCH ₃	CH ₂ OCH ₃	
1.135	Cl	CH ₂ -C ₆ H ₅	OCH ₃	
1.136	OCH ₃	Br	CH ₃	
1.137	Cl	C ₂ H ₄ OCH ₃	CH ₃	
1.138	OCH ₃	C ₂ H ₄ OC ₂ H ₅	CH ₃	
1.139	Cl	C ₆ H ₄ (OCH ₃)(4)	Cl	
1.140	Cl	C ₅ H ₁₁ -n	Cl	
1.141	C ₅ H ₁₁ -n	H	H	
1.142	CH ₃	CN	-S(O)CH ₃	
1.143	Cl	H	SCH ₃	zähe Masse
1.144	CH ₃	J	CH ₃	Harz
1.145	Cl	H	SCH ₂ CH=CH ₂	Harz
1.146	Cl	H	OCH ₂ CF ₃	
1.147	Cl	Cl	Cl	
1.148	Cl	Br	OCH ₃	
1.149	Cl	Br	OC ₂ H ₅	

Tabelle 1: (Fortsetzung)

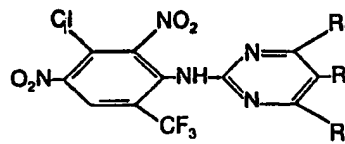
Verb. Nr.	R ₅	R ₆	R ₇	physikalische Konstante [°C]
1.150	Cl	Br	OC ₃ H ₇ -i	
1.151	Cl	Br	OC ₄ H ₉ -sek.	
1.152	Cl	Br	OCH ₂ CF ₃	
1.153	Cl	Br	OCH ₂ CH ₂ Cl	
1.154	Cl	Br	OCH ₂ CH ₂ Br	
1.155	Cl	Br	OCHF ₂	
1.156	Cl	Br	OCH ₂ CH ₂ OCH ₃	
1.157	Cl	Br	SC ₂ H ₅	
1.158	Cl	Br	SC ₃ H ₇ -i	
1.159	Cl	Br	OC(CH ₃) ₂ C≡CH	
1.160	Cl	Br	OCH ₂ -Phenyl	
1.161	Cl	Br	SCN	
1.162	Cl	Br	OCH ₂ C≡CH	
1.163	Cl	Br	OCH ₂ CH=CH ₂	

Tabelle 2: Verbindungen der Formel



Verb. Nr.	R ₃	R ₄	R ₆	R ₇	physikalische Konstante [°C]
2.1	F	Cl	H	Cl	Harz
2.2	J	Cl	H	Cl	Harz
2.3	Br	F	CH ₃	F	
2.4	Br	Cl	CH ₃	Cl	
2.5	F	Cl	OC ₂ H ₅	Cl	
2.6	J	C ₂ H ₅	H	H	
2.7	F	Cl	CH ₂ -C ₆ H ₅	Cl	
2.8	Br	OC ₂ H ₅	H	H	
2.9	Br	Cl	NO ₂	SCH ₃	
2.10	F	Cl	Cl	CH ₃	
2.11	Br	Cl	F	H	
2.12	F	SCH ₃	CN	H	
2.13	F	OCH ₃	CN	H	

Tabelle 3: Verbindungen der Formel



Verb. Nr.	R ₅	R ₆	R ₇	physikalische Konstante [°C]
3.1	Cl	H	OCH ₂ F	Harz
3.2	Cl	H	Cl	
3.3	SCH ₃	CN	H	
3.4	OCH ₃	CN	H	

Tabelle 3: (Fortsetzung)

Verb. Nr.	R ₅	R ₆	R ₇	physikalische Konstante [°C]
3.5	CH ₃	CH ₃	H	Harz
3.6	OCH ₃	Br	H	
3.7	OC ₃ H ₇ -i	H	OC ₃ H ₇ -i	
3.8	CH ₃	CN	H	
3.9	OC ₂ OC ₂ H ₅	H	CH ₃	
3.10	SC ₂ H ₅	H	CH ₃	
3.11	OC ₂ H ₅	H	F	
3.12	OCH ₃	OC ₂ H ₅	H	
3.13	OCH ₃	J	CH ₂ F	
3.14	CH ₃	CN	S(O)CH ₃	
3.15	OC ₂ H ₅	H	CH ₃	
3.16	C ₄ H ₉ -i	H	H	
3.17	Cl	CH ₃	H	
3.18	Cl	H	H	
3.19	C ₆ H ₅	CN	H	
3.20	H	CH ₂ -C ₆ H ₅	H	
3.21	CH ₃	CN	SO ₂ CH ₃	
3.22	C ₃ H ₇ -n	H	H	
3.23	Cl	OCH ₃	H	
3.24	CH ₂ OCH ₃	H	CH ₃	
3.25	CHBr ₂	Br	H	
3.26	OCH ₃	OCH ₃	H	
3.27	Cl	H	SC ₂ H ₅	
3.28	CH ₃	NO ₂	SO ₂ CH ₃	
3.29	SC ₃ H ₇ -i	H	CH ₃	
3.30	Cl	F	H	
3.31	OC ₂ H ₅	OCH ₃	H	
3.32	CH ₃	H	SC ₃ H ₇ -n	
3.33	OCH ₃	H	H	
3.34	CH ₃	C ₂ H ₄ OC ₂ H ₅	H	
3.35	Cl	H	SO ₂ CH ₃	
3.36	OC ₂ H ₅	NO ₂	H	
3.37	OCH ₃	F	H	
3.38	CH ₃	H	SCH ₃	
3.39	C ₄ H ₉ -n	H	CH ₃	
3.40	SC ₂ H ₅	H	H	
3.41	Cl	H	OC ₂ H ₅	
3.42	Cl	SO ₂ CH ₃	H	
3.43	C ₃ H ₇ -i	H	H	
3.44	H	C ₄ H ₉ -n	H	
3.45	CH ₂ OCH ₃	OCH ₃	H	
3.46	H	CN	H	
3.47	Cl	OC ₂ H ₅	H	
3.48	SO ₂ C ₂ H ₅	H	H	
3.49	CH ₃	H	O-C ₆ H ₅	
3.50	OCH ₂ -C ₆ H ₅	H	F	
3.51	Cl	H	SCH ₃	
3.52	F	H	F	
3.53	Cl	CH ₂ -C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	
3.54	H	Br	H	
3.55	Cl	SCH ₃	H	
3.56	CCl ₃	H	CCl ₃	
3.57	H	C ₃ H ₇ -i	H	
3.58	CH ₃	H	CF ₃	
3.59	Cl	S-C ₆ H ₅	H	
3.60	OC ₃ H ₇ -i	H	CH ₃	
3.61	Cl	H	SCN	
3.62	CH ₂ -C ₆ H ₅	H	CH ₃	
3.63	Cl	CH ₂ -C ₆ H ₅	Cl	
3.64	SCH ₂ -C ₆ H ₅	H	CH ₃	
3.65	Cl	Br	Cl	

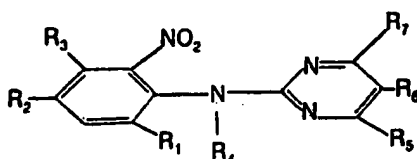
Tabelle 3: (Fortsetzung)

Verb. Nr.	R ₅	R ₆	R ₇	physikalische Konstante [°C]
3.66	Cl	CH ₂ -C ₆ H ₅	CH ₃	Harz
3.67	OC ₂ H ₅	H	CH ₂ F	
3.68	Cl	C ₆ H ₅	Cl	
3.69	Cl	Cl	Cl	
3.70	H	CH ₃	H	Harz
3.71	SCH ₂ -C ₆ H ₅	H	SCH ₂ -C ₆ H ₅	
3.72	OCH ₃	H	CH ₂ OC ₂ H ₅	
3.73	Cl	CH ₃	Cl	
3.74	H	OC ₄ H ₉	H	Harz
3.75	Cl	OC ₂ H ₅	Cl	
3.76	Cl	Cl	CH ₃	
3.77	Cl	C ₅ H ₉ -n	CH ₃	
3.78	SCH ₃	H	SCH ₃	Harz
3.79	Cl	C ₄ H ₉ -n	Cl	
3.80	H	OC ₄ H ₉ -sek.	H	
3.81	Cl	H	CH ₂ Cl	
3.82	CH ₃	C ₆ H ₅	CH ₃	Harz
3.83	CH ₃	CH ₃	CH ₃	
3.84	H	Cyclohexyl	H	
3.85	SC ₃ H ₇ -n	H	SC ₃ H ₇ -n	
3.86	H	OC ₂ H ₅	H	Harz
3.87	Cl	CN	OCH ₃	
3.88	OCH ₃	H	CH ₂ F	
3.89	OCH ₃	OCH ₃	OCH ₃	
3.90	C ₂ H ₅	H	Cl	Harz
3.91	CN	H	CH ₃	
3.92	Cl	NO ₂	OCH ₃	
3.93	H	OC ₂ H ₄ OCH ₃	H	
3.94	Cl	H	C ₆ H ₅	Harz
3.95	CH ₃	CH ₂ -CH=CH ₂	CH ₃	
3.96	C ₆ H ₅	H	C ₆ H ₅	
3.97	SC ₄ H ₉ -n	H	CH ₃	
3.98	CH ₃	H	C ₆ H ₅	Harz
3.99	Br	H	Br	
3.100	OC ₂ H ₅	H	OC ₂ H ₅	
3.101	H	CH ₂ OCH ₃	H	
3.102	Cl	OCH ₃	Cl	Harz
3.103	OCH ₃	H	SCH ₃	
3.104	Cl	OCH ₃	CH ₃	
3.105	Cl	C ₃ H ₇ -n	C ₆ H ₅	
3.106	Cl	C ₆ H ₃ Cl ₂ (2,4)	Cl	Harz
3.107	Cl	H	SC ₃ H ₇ -n	
3.108	Cl	C ₆ H ₄ (CH ₃)(4)	Cl	
3.109	Cl	Br	CH ₃	
3.110	Cl	C ₂ H ₅	Cl	Harz
3.111	Cl	C ₆ H ₄ (OCH ₃)(4)	Cl	
3.112	Cl	CH ₃	C ₆ H ₅	
3.113	C ₆ H ₄ (CF ₃)(4)	CN	H	
3.114	Cl	C ₆ H ₄ (NO ₂)(4)	Cl	Harz
3.115	Cl	H	SCH ₃	
3.116	Cl	H	OCH ₂ CH=CH ₂	
3.117	C ₆ H ₁₃ -n	H	H	
3.118	Cl	H	OCH ₂ C≡CH	Harz
3.119	Cl	H	SCH ₃	
3.120	Cl	Cl	OCH ₃	
3.121	Cl	Cl	OC ₂ H ₅	
3.122	Cl	Cl	OC ₄ H ₉ -sek.	Harz
3.123	Cl	Cl	OC ₄ H ₉ -tert.	
3.124	Cl	Cl	OCH ₂ CF ₃	
3.125	Cl	Cl	OCHF ₂	
3.126	Cl	Cl	OCH ₂ CH ₂ Cl	

Tabelle 3: (Fortsetzung)

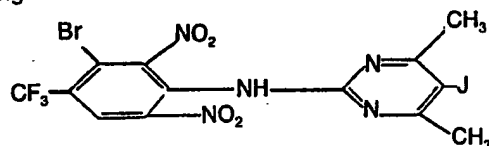
Verb. Nr.	R ₅	R ₆	R ₇	physikalische Konstante [°C]
3.127	Cl	Cl	OCH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅	semikristallin
3.128	Cl	Cl	OC(CH ₃) ₂ ≡CH	
3.129	Cl	Cl	OCH ₂ -Phenyl	
3.130	Cl	Cl	SCN	
3.131	Cl	Cl	SC ₂ H ₅	
3.132	Cl	Cl	SC ₃ H ₇ -I	
3.132	Cl	Cl	OCH ₂ C≡CH	
3.133	Cl	Cl	OCH ₂ =CH ₂	

Tabelle 4: Verbindungen der Formel



Verb. Nr.	R ₁	R ₂	R ₃	R ₄	R ₅	R ₆	R ₇	physikalische Konstante [°C]
5.1	NO ₂	CF ₃	Cl	C(O)CH ₃	Cl	H	Cl	
5.2	CF ₃	NO ₂	Cl	C(O)CH ₃	Cl	H	Cl	
5.3	NO ₂	CF ₃	Cl	C(O)CH ₂ Cl	Cl	C ₄ H ₉ -n	Cl	
5.4	NO ₂	CF ₃	Cl	C(O)CH ₂ OCH ₃	Cl	CH ₃	Cl	
5.5	NO ₂	CF ₃	Cl	C(O)CH ₃	Cl	OC ₂ H ₅	Cl	
5.6	CF ₃	NO ₂	Cl	C(O)CH ₂ OC ₂ H ₅	Cl	CH ₃	Cl	
5.7	CF ₃	NO ₂	Cl	C(O)CH ₂ OCH ₃	Cl	CN	CH ₃	
5.8	NO ₂	CF ₃	Cl	C(O)CH ₃	SCH ₃	CN	H	
5.9	NO ₂	CF ₃	Cl	C(O)CH ₃	OCH ₃	CN	H	

sowie die Verbindung

zähe Masse
Verb. Nr. 6.1Formulierungsbeispiele für flüssige Wirkstoffe der Formel I
(% = Gewichtsprozent)

F1. Emulsions-Konzentrate	a)	b)	c)
Wirkstoff aus den Tabellen	25%	40%	50%
Ca-Dodecylbenzolsulfonat	5%	8%	6%
Ricinusöl-polyethylenglykolether (36 Mol Ethylenoxid)	5%	—	—
Tributylphenoyl-polyethylenglykol- ether (30 Mol Ethylenoxid)	—	12%	4%
Cyclohexanon	—	15%	20%
Xylolemisch	65%	25%	20%

Aus solchen Konzentraten können durch Verdünnen mit Wasser
Emulsionen jeder gewünschten Konzentration hergestellt wer-
den.

F2. Lösungen	a)	b)	c)	d)
Wirkstoff aus den Tabellen	80%	10%	5%	95%
Ethylenglykol-monomethyl-ether	20%	—	—	—
Polyethylenglykol M G 400	—	70%	—	—
N-Methyl-2-pyrrolidon	—	20%	—	—
Epoxidiertes Kokosnussöl	—	—	1%	5%
Benzin (Siedegrenzen 160–190 °C)	—	—	94%	—
(MG = Molekulargewicht)	—	—	94%	—

Die Lösungen sind zur Anwendung in Form kleinster Tropfen geeignet.

F3. Granulate	a)	b)
Wirkstoff aus den Tabellen	5%	10%
Kaolin	94%	—
Hochdisperse Kieselsäure	1%	—
Attapulgit	—	90%

Der Wirkstoff wird in Methylenchlorid gelöst, auf den Träger aufgesprüht und das Lösungsmittel anschliessend im Vakuum abgedampft.

F4. Stäubemittel	a)	b)
Wirkstoff aus den Tabellen	2%	5%
Hochdisperse Kieselsäure	1%	5%
Talkum	97%	—
Kaolin	—	90%

Durch inniges Vermischen auf Trägerstoffe mit dem Wirkstoff erhält man gebrauchsfertige Stäubemittel.

Formulierungsbeispiele für feste Wirkstoffe der Formel I
(% = Gewichtsprozent)

F5. Spritzpulver	a)	b)	b)
Wirkstoff aus den Tabellen	25%	50%	75%
Na-Ligninsulfonat	5%	5%	—
Na-Laurylsulfat	3%	—	5%
Na-Diisobutyl-naphthalinsulfonat	—	6%	10%
Octylphenolpolyethylenglykolether (7–8 Mol Ethylenoxid)	—	2%	—
Hochdisperse Kieselsäure	5%	10%	10%
Kaolin	62%	27%	—

Der Wirkstoff wird mit den Zusatzstoffen gut vermischt und in einer geeigneten Mühle gut vermahlen. Man erhält Spritzpulver, die sich mit Wasser zu Suspensionen jeder gewünschten Konzentration verdünnen lassen.

F6. Emulsions-Konzentrat

Wirkstoff aus den Tabellen	10%
Octylphenolpolyethylenglykoether (4-5 Mol Ethylenoxid)	3%
Ca-Dodecylbenzolsulfonat	3%
Ricinusölpolyglykoether (35 Mol Ethylenoxid)	4%
Cyclohexanon	30%
Xyloigemisch	50%

Aus diesem Konzentrat können durch Verdünnen mit Wasser .
Emulsionen jeder gewünschten Konzentration hergestellt werden.

F7. Stäubemittel

	a)	b)
Wirkstoff aus den Tabellen	5%	8%
Talkum	95%	—
Kaolin	—	92%

Man erhält anwendungsfertige Stäubemittel, in dem der Wirkstoff
mit dem Träger vermischt auf einer geeigneten Mühle
vermahlen wird.

F8. Extruder Granulat

Wirkstoff aus den Tabellen	10%
N-Ligninsulfonat	2%
Carboxymethylcellulose	1%
Kaolin	87%

Der Wirkstoff wird mit den Zusatzstoffen vermischt, vermahlen
und mit Wasser angefeuchtet. Dieses Gemisch wird extrudiert
und anschliessend im Luftstrom getrocknet.

F9. Umhüllungs-Granulat

Wirkstoff aus den Tabellen	3%
Polyethylenglykol (MG 200)	3%
Kaolin	94%

(MG = Molekulargewicht)

Der fein gemahlene Wirkstoff wird in einem Mischer auf das mit
Polyethylenglykol angefeuchtete Kaolin gleichmässig
aufgetragen. Auf diese Weise erhält man staubfreie Umhüllungs-
Granulate.

F10. Suspensions-Konzentrat

Wirkstoff aus den Tabellen	40%
Ethylenglykol	10%
Nonylphenolpolyethylenglykoether (15 Mol Ethylenoxid)	6%
N-Ligninsulfonat	10%
Carboxymethylcellulose	1%
37%ige wässrige Formaldehyd-Lösung	0,2%
Silikonöl in Form einer 75%igen wässrigen Emulsion	0,8%
Wasser	32%

Der fein gemahlene Wirkstoff wird mit den Zusatzstoffen innig vermischt. Man erhält so ein Suspensions-Konzentrat, aus welchem durch Verdünnen mit Wasser Suspensionen jeder gewünschten Konzentration hergestellt werden können.

Biologische Beispiele:

Beispiel B1:

Wirkung gegen *Puccinia graminis* auf Weizen

a) Residual-protective Wirkung

Weizenpflanzen wurden 6 Tage nach der Aussaat mit einer aus Spritzpulver des Wirkstoffes hergestellten Spritzbrühe (0,02% Aktivsubstanz) besprüht. Nach 24 Stunden wurden die behandelten Pflanzen mit einer Uredosporensuspension des Pilzes infiziert. Nach einer Inkubation während 48 Stunden bei 95–100% relativer Luftfeuchtigkeit und ca. 20°C wurden die infizierten Pflanzen in einem Gewächshaus bei ca. 22°C aufgestellt. Die Beurteilung der Rostpustelentwicklung erfolgte 12 Tage nach der Infektion.

b) Systemische Wirkung

Zu Weizenpflanzen wurden 5 Tage nach Aussaat eine aus Spritzpulver des Wirkstoffes hergestellte Spritzbrühe gegossen (0,006% Aktivsubstanz bezogen auf das Bodenvolumen). Nach 48 Stunden wurden die behandelten Pflanzen mit einer Uredosporensuspension des Pilzes infiziert. Nach einer Inkubation während 48 Stunden bei 95–100% relativer Luftfeuchtigkeit und ca. 20°C wurden die infizierten Pflanzen in einem Gewächshaus bei ca. 22°C aufgestellt. Die Beurteilung der Rostpustelentwicklung erfolgte 12 Tage nach der Infektion.

Verbindungen aus der Tabelle zeigten gegen *Puccinia*-Pilze eine sehr gute Wirkung. Unbehandelte aber infizierte Kontrollpflanzen zeigten einen *Puccinia*-Befall von 100%. Unter anderem hemmten die Verbindungen 1.1 bis 1.19, 1.22, 1.32, 1.44, 1.52, 1.54, 1.62, 1.63, 1.71, 1.75, 1.88, 1.114, 1.143, 1.144, 1.145, 2.2, 3.1, 3.13, 3.72, 3.116 und 3.128 den *Puccinia*-Befall auf 0 bis 15%.

Beispiel B2:

Wirkung gegen *Cercospora arachidicola* auf Erdnusspflanzen

Residual-protective Wirkung

10–15 cm hohe Erdnusspflanzen wurden mit einer aus Spritzpulver der Wirksubstanz hergestellten Spritzbrühe (0,006 Aktivsubstanz) besprüht und 48 Stunden später mit einer Konidiensuspension des Pilzes infiziert. Die infizierten Pflanzen wurden während 72 Stunden bei ca. 21°C und hoher Luftfeuchtigkeit inkubiert und anschließend bis zum Auftreten der typischen Blattflecken in einem Gewächshaus aufgestellt.

Die Beurteilung der fungiziden Wirkung erfolgt 12 Tage nach der Infektion basierend auf Anzahl und Grösse der auftretenden Flecken.

Im Vergleich zu unbehandelten, aber infizierten Kontrollpflanzen (Anzahl und Grösse der Flecken = 100%), zeigten Erdnusspflanzen, die mit Wirkstoffen aus den Tabellen behandelt wurden, einen stark reduzierten *Cercospora*-Befall. So verhin-

derten die Verbindungen 1.1 bis 1.19, 1.22, 1.32, 1.44, 1.52, 1.54, 1.62, 1.63, 1.71, 1.75, 1.88, 1.114, 1.143, 1.144, 1.145, 2.2, 3.1, 3.13, 3.72, 3.116 und 3.128 in obigen Versuchen das Auftreten von Flecken fast vollständig (0–10%).

Beispiel B3:

Wirkung gegen *Erysiphe graminis* auf Gerste

a) Residual-protective Wirkung

Ca. 8 cm hohe Gerstenpflanzen wurden mit einer aus Spritzpulver des Wirkstoffes hergestellten Spritzbrühe (0,002% Aktivsubstanz) besprüht. Nach 3–4 Stunden wurden die behandelten Pflanzen mit Konidien des Pilzes bestäubt. Die infizierten Gerstenpflanzen wurden in einem Gewächshaus bei ca. 22°C aufgestellt und der Pilzbefall nach 10 Tagen beurteilt.

b) Systemische Wirkung

Zu ca. 8 cm hohen Gerstenpflanzen wurde eine aus Spritzpulver des Wirkstoffes hergestellte Spritzbrühe gegossen (0,006% Aktivsubstanz bezogen auf das Erdvolumen). Es wurde dabei darauf geachtet, dass die Spritzbrühe nicht mit den oberirdischen Pflanzenteilen in Berührung kam. Nach 48 Stunden wurden die behandelten Pflanzen mit Konidien des Pilzes bestäubt. Die infizierten Gerstenpflanzen wurden in einem Gewächshaus bei ca. 22°C aufgestellt und der Pilzbefall nach 10 Tagen beurteilt.

Verbindungen der Formel I zeigten gute Wirkung gegen Erysiphe-Pilze. Unbehandelte, aber infizierte Kontrollpflanzen zeigten einen Erysiphe-Befall von 100%. Unter anderen Verbindungen aus den Tabellen 1 und 2 hemmten den Pilzbefall bei Gerste auf weniger als 30%.

Beispiel B4:

Residual-protective Wirkung gegen *Venturia inaequalis* auf Apfeltrieben

Apfelstecklinge mit 10–20 cm langen Frischtrieben wurden mit einer aus Spritzpulver des Wirkstoffes hergestellten Spritzbrühe (0,006% Aktivsubstanz) besprüht. Nach 24 Stunden wurden die behandelten Pflanzen mit einer Konidiensuspension des Pilzes infiziert. Die Pflanzen wurden dann während 5 Tagen bei 90–100% relativer Luftfeuchtigkeit inkubiert und während 10 weiteren Tagen in einem Gewächshaus bei 20–24°C aufgestellt. Der Schorfbefall wurde 15 Tage nach der Infektion beurteilt. Verbindungen aus den Tabellen 1 und 2 hemmten den Krankheitsbefall auf weniger als 25%. Unbehandelte aber infizierte Kontrolltriebe wurden dagegen 100%ig befallen.

Beispiel B5:

Wirkung gegen *Botrytis cinerea* auf Bohnen

Residual-protective Wirkung

Ca. 10 cm hohe Bohnen-Pflanzen wurden mit einer aus Spritzpulver des Wirkstoffes hergestellten Spritzbrühe (0,02% Aktivsubstanz) besprüht. Nach 48 Stunden wurden die behandelten Pflanzen mit einer Konidiensuspension des Pilzes infiziert. Nach einer Inkubation der infizierten Pflanzen während 3 Tagen bei 95–100% relativer Luft-

feuchtigkeit und 21 °C erfolgte die Beurteilung des Pilzbefalls. Die Verbindungen aus der Tabelle hemmten in vielen Fällen die Pilzinfektion sehr stark. Bei einer Konzentration von 0,02% erwiesen sich z.B. die Verbindungen 1.1, 1.2, 1.4, 1.6, 1.8, 1.11, 1.15 und 2.2 als voll wirksam. Der Krankheitsbefall lag bei 0 bis 8%. Der Botrytis-Befall unbehandelter aber infizierter Bohnenpflanzen betrug 100%.

Beispiel B6:

Wirkung gegen *Phytophthora infestans* auf Tomatenpflanzen

a) Residual-protektive Wirkung

Tomatenpflanzen wurden nach 3-wöchiger Anzucht mit einer aus Spritzpulver des Wirkstoffes hergestellten Spritzbrühe (0,06% Aktivsubstanz) besprüht. Nach 24 Stunden wurden die behandelten Pflanzen mit einer Sporangiensuspension des Pilzes infiziert. Die Beurteilung des Pilzbefalls erfolgte nach einer Inkubation der infizierten Pflanzen während 5 Tagen bei 90–100% relativer Luftfeuchtigkeit und 20 °C.

b) Systemische Wirkung

Zu Tomatenpflanzen wurde nach 3-wöchiger Anzucht eine aus Spritzpulver des Wirkstoffes hergestellte Spritzbrühe gegossen (0,06% Aktivsubstanz bezogen auf das Erdvolumen). Es wurde dabei darauf geachtet, dass die Spritzbrühe nicht mit den oberirdischen Pflanzenteilen in Berührung kam. Nach 48 Stunden wurden die behandelten Pflanzen mit einer Sporangiensuspension des Pilzes infiziert. Die Beurteilung des Pilzbefalls erfolgte nach einer Inkubation der infizierten Pflanzen während 5 Tagen bei 90–100% relativer Luftfeuchtigkeit und 20 °C.

Unter anderen zeigten in obigen Versuchen die Verbindungen Nr. 1.1, 1.2, 1.4, 1.6, 1.8 bis 1.20, 1.22, 1.29, 1.44, 1.63, 1.75, 1.88, 1.43 bis 1.45, 2.2, 3.1 und 3.116 eine sehr gute systemische Wirkung. Gegenüber unbehandelten Kontrollpflanzen (100% Befall) bewirkten diese Verbindungen eine fast vollständige Unterdrückung des Pilzbefalls (0 bis 5%).

Beispiel B7:

Wirkung gegen *Plasmopara viticola* auf Reben

a) Residual-protektive Wirkung

Im 4–5 Blattstadium wurden Rebensämlinge mit einer aus Spritzpulver des Wirkstoffes hergestellten Spritzbrühe (0,06% Aktivsubstanz) besprüht. Nach 24 Stunden wurden die behandelten Pflanzen mit einer Sporangiensuspension des Pilzes infiziert. Nach einer Inkubation während 6 Tagen bei 95–100% relativer Luftfeuchtigkeit und 20 °C wurde der Pilzbefall beurteilt.

b) Residual-kurative Wirkung

Im 4–5 Blattstadium wurden Rebensämlinge mit einer Sporangiensuspension des Pilzes infiziert. Nach einer Inkubation während 24 Stunden in einer Feuchtkammer bei 95–100% relativer Luftfeuchtigkeit und 20 °C wurden die infizierten Pflanzen getrocknet und mit einer aus Spritzpulver des

Wirkstoffes hergestellten Spritzbrühe (0,06% Aktivsubstanz) besprüht. Nach dem Antrocknen des Spritzbelages wurden die behandelten Pflanzen wieder in die Feuchtkammer gebracht. Die Beurteilung des Pilzbefalls erfolgte 6 Tage nach der Infektion.

Verbindungen aus den Tabellen zeigten gegen *Plasmopara viticola* auf Reben eine sehr gute fungizide Wirkung, insbesondere die Wirkstoffe Nr. 1.1, 1.4, 1.6, 1.8 und 1.11 bewirkten eine vollständige Unterdrückung des Pilzbefalls (0 bis 5%).

Beispiel B8:

Wirkung gegen *Piricularia oryzae* auf

Reispflanzen

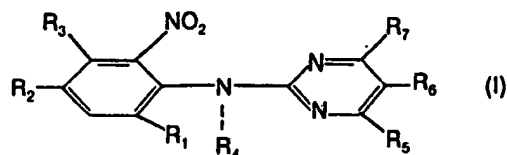
Residual-protektive Wirkung

Reispflanzen wurden nach zweiwöchiger Anzucht mit einer aus Spritzpulver des Wirkstoffes hergestellten Spritzbrühe (0,02% Aktivsubstanz) besprüht. Nach 48 Stunden wurden die behandelten Pflanzen mit einer Konidiensuspension des Pilzes infiziert. Nach 5 Tagen Inkubation bei 95–100% relativer Luftfeuchtigkeit und 24 °C wurde der Pilzbefall beurteilt.

Reispflanzen, die mit einer Spritzbrühe behandelt worden sind, die als Aktivsubstanz eine der Verbindungen 1.1, 1.4, 1.6, 1.8 und 2.2 enthielt, zeigten im Vergleich zu unbehandelten Kontrollpflanzen (100% Befall) weniger als 10% Pilzbefall.

Patentansprüche für die Vertragsstaaten: GB, BE, DE, FR, IT, LU, NL, SE, CH, LI

1. Verbindungen der allgemeinen Formel I



worin

R₁ und R₂ für Wasserstoff, NO₂ oder CF₃ stehen, mit der Massgabe, dass nur R₁ oder R₂ für NO₂ stehen kann;

R₃ Halogen bedeutet;

R₄ für Wasserstoff oder die Gruppe –C(O)R' steht, wobei R' unsubstituiertes oder durch Halogen, C₁–C₃-Alkoxy oder C₁–C₃-Alkylthio substituiertes C₁–C₄-Alkyl bedeutet;

R₅, R₆ und R₇ unabhängig voneinander für Wasserstoff, Halogen, Nitro, Cyano, Rhodano, C₁–C₁₂-Alkyl, C₃–C₈-Cycloalkyl, C₁–C₆-Alkylthio, C₁–C₆-Alkylsulfonyl, C₁–C₆-Alkylsulfoxy, C₃–C₈-Alkenyl, C₃–C₈-Haloalkenyl, C₃–C₈-Alkynyl, C₃–C₈-Haloalkynyl, C₃–C₈-Alkenyloxy, C₃–C₈-Haloalkenyloxy, C₃–C₈-Alkenylthio, C₃–C₈-Alkinyloxy, C₃–C₈-Haloalkinyloxy, durch Halogen, Cyano, und/oder C₁–C₃-Alkoxy substituiertes C₁–C₆-Alkyl, unsubstituiertes oder durch Halogen substituiertes C₁–C₆-Alkoxy, dessen Alkylteil gegebenenfalls durch ein oder mehrere einzelne Sauerstoffatome unterbrochen ist oder für die Gruppe Q–(E)_n–(X)_m stehen, wobei n für 0 oder 1 steht, m für 0 oder 1 steht, Q für ein

unsubstituiertes oder durch Halogen, Nitro, C_1-C_3 -Alkyl, CF_3 und/oder C_1-C_3 -Alkoxy substituiertes Phenyl oder einen gesättigten oder ungesättigten fünf- oder sechsgliedrigen Heterocyclus mit ein bis drei gleichen oder verschiedenen Heteroatomen, wie Sauerstoff, Stickstoff oder Schwefel, E eine C_1-C_3 Alkylenbrücke bedeutet und X für Sauerstoff oder Schwefel steht.

2. Verbindungen der Formel I nach Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, dass

R_1 für NO_2 oder CF_3 steht;

R_2 für NO_2 oder CF_3 steht; mit der Massgabe, dass nur R_1 oder R_2 NO_2 sein kann;

R_3 Halogen bedeutet;

R_4 für Wasserstoff oder die Gruppe $-C(O)R'$ steht, wobei R' unsubstituiertes oder durch Halogen, C_1-C_3 -Alkoxy oder C_1-C_3 -Alkylthio substituiertes C_1-C_4 -Alkyl bedeutet;

R_5 , R_6 und R_7 unabhängig voneinander für Wasserstoff, Halogen, Nitro, Cyano, Rhodano, C_1-C_{12} -Alkyl, C_3-C_8 -Cycloalkyl, C_1-C_6 -Alkylthio, C_1-C_6 -Alkylsulfonyl, C_1-C_6 -Alkylsulfoxyl, C_3-C_6 -Alkenyl, C_3-C_6 -Haloalkenyl, C_3-C_6 -Alkynyl, C_3-C_6 -Haloalkynyl, durch Halogen, Cyano und/oder C_1-C_4 -Alkoxy substituiertes C_1-C_8 -Alkyl, unsubstituiertes oder durch Halogen substituiertes C_1-C_8 -Alkoxy, dessen Alkylteil gegebenenfalls durch ein oder mehrere einzelne Sauerstoffatome unterbrochen ist oder für die Gruppe $Q-(E)_n-(X)_m$ stehen, wobei n für 0 oder 1 steht, m für 0 oder 1 steht, Q für ein unsubstituiertes oder durch Halogen, Nitro, C_1-C_3 -Alkyl, CF_3 und/oder C_1-C_3 -Alkoxy substituiertes Phenyl oder einen gesättigten oder ungesättigten fünf- oder sechsgliedrigen Heterocyclus mit einem bis drei Heteroatomen, wie Sauerstoff, Stickstoff oder Schwefel, steht, E eine C_1-C_3 Alkylenbrücke bedeutet und X für Sauerstoff oder Schwefel steht.

3. Verbindungen der Formel I nach Anspruch 2, dadurch gekennzeichnet, dass R_1 , R_2 , R_3 und R_4 die unter Formel I angegebenen Bedeutungen haben und R_5 , R_6 und R_7 unabhängig voneinander für Wasserstoff, Halogen, Nitro, Cyano, C_1-C_6 -Alkyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl, C_1-C_3 -Alkylthio, C_1-C_3 -Alkylsulfonyl, C_1-C_3 -Alkylsulfoxyl, C_3-C_4 -Alkenyl, Propargyl, durch Halogen, Cyano und/oder C_1-C_3 -Alkoxy substituiertes C_1-C_3 -Alkyl, C_1-C_6 -Alkoxy, dessen Alkylteil durch ein bis 2 einzelne Sauerstoffatome unterbrochen ist oder für die Gruppe $Q-(E)_n-(X)_m$ stehen, worin n für 0 oder 1 und m für 0 oder 1 steht, Q für ein unsubstituiertes oder durch Halogen, Nitro, Methyl, CF_3 oder Methoxy substituiertes Phenyl oder eine Pyridylgruppe steht, E für eine Methylenbrücke steht und X Sauerstoff oder Schwefel bedeutet.

4. Verbindungen der Formel I nach Anspruch 3, dadurch gekennzeichnet, dass R_1 , R_2 und R_3 die unter Formel I angegebenen Bedeutungen haben, R_4 für Wasserstoff steht, und R_5 , R_6 und R_7 unabhängig voneinander für Wasserstoff, Halogen, Nitro, Cyano, C_1-C_6 -Alkyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl, C_1-C_3 -Alkylthio, C_1-C_3 -Alkylsulfonyl, C_1-C_3 -Alkylsulfoxyl, C_3-C_4 -Alkenyl, Propargyl, durch Halogen, Cyano und/oder C_1-C_3 -Alkoxy substituiertes C_1-C_3 -Alkyl,

C_1-C_6 -Alkoxy, dessen Alkylteil durch ein bis 2 einzelne Sauerstoffatome unterbrochen ist oder für die Gruppe $Q-(E)_n-(X)_m$ stehen, worin n für 0 oder 1 und m für 0 oder 1 steht, Q für ein unsubstituiertes oder durch Halogen, Nitro, Methyl, CF_3 oder Methoxy substituiertes Phenyl oder eine Pyridylgruppe steht, E für eine Methylenbrücke steht und X Sauerstoff oder Schwefel bedeutet.

5. Verbindungen der Formel I nach Anspruch 4, dadurch gekennzeichnet, dass R_1 für NO_2 oder CF_3 steht; mit der Massgabe, dass nur R_1 oder R_2 NO_2 sein kann; R_2 für NO_2 oder CF_3 steht; R_3 Chlor bedeutet; R_4 für Wasserstoff steht; R_5 Wasserstoff bedeutet und R_6 und R_7 unabhängig voneinander für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, C_1-C_3 -Alkyl, C_1-C_3 -Haloalkyl, C_1-C_3 -Alkoxy, C_1-C_3 -Haloalkoxy, unsubstituiertes oder durch Halogen substituiertes Phenoxy, OCH_2OCH_3 , $OC_2H_4OCH_3$, $OCH_2OC_2H_5$, $OC_2H_4OC_2H_5$, $OC_2H_4OC_2H_4OC_2H_5$ oder $-S-(2-Pyridyl)$ stehen.

6. Eine Verbindung der Formel I nach Anspruch 1, ausgewählt aus der Reihe:

N-(3'-Chlor-2',6'-dinitro-4'-trifluormethylphenyl)-2-amino-4,6-dichlorpyrimidin,

N-(3'-Chlor-2',6'-dinitro-4'-trifluormethylphenyl)-2-amino-4-chlor-6-trichlormethylpyrimidin,

N-(3'-Chlor-2',6'-dinitro-4'-trifluormethylphenyl)-2-amino-4,6-dimethylpyrimidin,

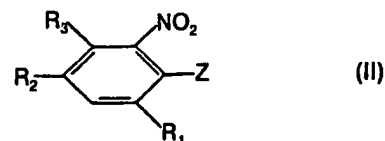
N-(3'-Chlor-2',6'-dinitro-4'-trifluormethylphenyl)-2-amino-4-trichlormethyl-6-(methoxyethoxy)pyrimidin,

N-(3'-Chlor-2',6'-dinitro-4'-trifluormethylphenyl)-2-amino-4-methoxy-6-(2-pyridylthio)pyrimidin,

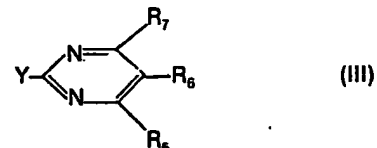
N-(3'-Chlor-2',6'-dinitro-4'-trifluormethylphenyl)-2-amino-4-trichlormethyl-6-(ethoxyethoxyethoxy)pyrimidin und

N-(3'-Chlor-2',6'-dinitro-4'-trifluormethylphenyl)-2-amino-4-methoxy-6-(4'-chlorphenoxy)pyrimidin.

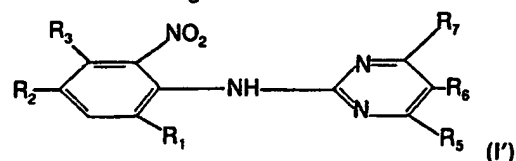
7. Verfahren zur Herstellung von Verbindungen der Formel I, dadurch gekennzeichnet, dass man eine Verbindung der Formel II



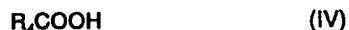
in Gegenwart einer Base mit einem Pyrimidin-Derivat der Formel III



zu einer Verbindung der Formel I'



umsetzt, und letztere zur Herstellung N-acylierter Derivate mit einem reaktionsfähigen Derivat der Carbonsäure IV



N-acyliert, wobei die Substituenten R_1 bis R_7 die unter Formel I angegebenen Bedeutungen haben und Z und Y für NH_2 oder Halogen stehen, wobei in dem Fall, in dem Z für Halogen steht, Y NH_2 bedeutet und in dem Fall in dem Z für NH_2 steht, Y Halogen bedeutet.

8. Mittel zur Bekämpfung oder Verhütung eines Befalls durch phytopathogene Schädlinge, dadurch gekennzeichnet, dass es als mindestens eine aktive Komponente eine Verbindung der Formel I zusammen mit üblichen Zuschlagstoffen und Trägermaterialien enthält.

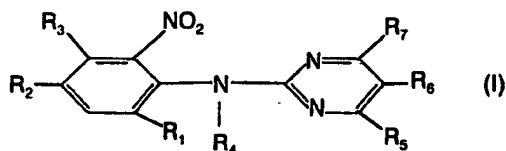
9. Mittel gemäss Anspruch 8, dadurch gekennzeichnet, dass es als mindestens eine aktive Komponente eine Verbindung der Formel I gemäss Anspruch 2 enthält.

10. Mittel zur Bekämpfung von Mikroorganismen gemäss Anspruch 8, dadurch gekennzeichnet, dass es als mindestens eine aktive Komponente eine Verbindung der Formel I gemäss einem der Ansprüche 3 bis 6 enthält.

11. Verfahren zur Bekämpfung oder Verhütung eines Befalls von Kulturpflanzen durch phytopathogene Schädlinge, dadurch gekennzeichnet, dass man eine Verbindung der Formel I auf die Pflanze oder deren Standort appliziert.

Patentansprüche für den Vertragsstaat AT

1. Verfahren zur Herstellung von Verbindungen der Formel I



worin

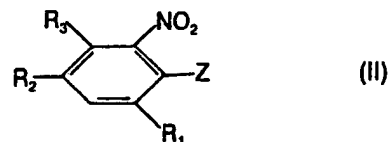
R_1 und R_2 für Wasserstoff, NO_2 oder CF_3 stehen, mit der Massgabe, dass nur R_1 oder R_2 für NO_2 stehen kann;

R_3 Halogen bedeutet;

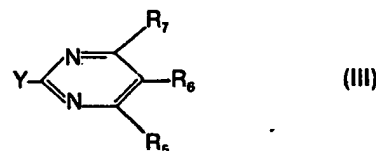
R_4 für Wasserstoff oder die Gruppe $-\text{C}(\text{O})\text{R}'$ steht, wobei R' unsubstituiertes oder durch Halogen, $\text{C}_1\text{--C}_3\text{--Alkoxy}$ oder $\text{C}_1\text{--C}_3\text{--Alkylthio}$ substituiertes $\text{C}_1\text{--C}_4\text{--Alkyl}$ bedeutet;

R_5 , R_6 und R_7 unabhängig voneinander für Wasserstoff, Halogen, Nitro, Cyano, Rhodano, $\text{C}_1\text{--C}_{12}\text{--Alkyl}$, $\text{C}_3\text{--C}_8\text{--Cycloalkyl}$, $\text{C}_1\text{--C}_8\text{--Alkylthio}$, $\text{C}_1\text{--C}_8\text{--Alkylsulfonyl}$, $\text{C}_1\text{--C}_8\text{--Alkylsulfoxy}$, $\text{C}_3\text{--C}_8\text{--Alkenyl}$, $\text{C}_3\text{--C}_8\text{--Haloalkenyl}$, $\text{C}_3\text{--C}_8\text{--Alkynyl}$, $\text{C}_3\text{--C}_8\text{--Haloalkynyl}$, $\text{C}_3\text{--C}_8\text{--Alkenylenoxy}$, $\text{C}_3\text{--C}_8\text{--Haloalkenyloxy}$, $\text{C}_3\text{--C}_8\text{--Alkenylthio}$, $\text{C}_3\text{--C}_8\text{--Alkinyloxy}$, $\text{C}_3\text{--C}_8\text{--Haloalkinyloxy}$, durch Halogen, Cyano und/oder $\text{C}_1\text{--C}_4\text{--Alkoxy}$ substituiertes $\text{C}_1\text{--C}_8\text{--Alkyl}$, unsubstituiertes oder durch Halogen substituiertes $\text{C}_1\text{--C}_8\text{--Alkoxy}$, dessen Alkylteil gegebenenfalls

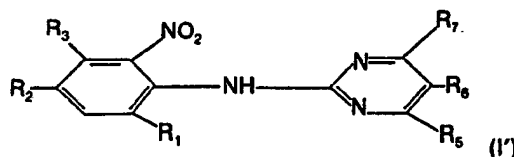
durch ein oder mehrere einzelne Sauerstoffatome unterbrochen ist oder für die Gruppe $\text{Q}-(\text{E})_n-(\text{X})_m$ stehen, wobei n für 0 oder 1 steht, m für 0 oder 1 steht, Q für ein unsubstituiertes oder durch Halogen, Nitro, $\text{C}_1\text{--C}_3\text{--Alkyl}$, CF_3 und/oder $\text{C}_1\text{--C}_3\text{--Alkoxy}$ substituiertes Phenyl oder einen gesättigten oder ungesättigten fünf- oder sechsgliedrigen Heterocyclus mit ein bis drei gleichen oder verschiedenen Heteroatomen, wie Sauerstoff, Stickstoff oder Schwefel, steht, E eine $\text{C}_1\text{--C}_3\text{--Alkyl}$ brücke bedeutet und X für Sauerstoff oder Schwefel steht, dadurch gekennzeichnet, dass man eine Verbindung der Formel II



in Gegenwart einer Base mit einem Pyrimidin-Derivat der Formel III



zu einer Verbindung der Formel I'



umsetzt, und letztere zur Herstellung N-acylierter Derivate mit einem reaktionsfähigen Derivat der Carbonsäure IV



N-acyliert, wobei die Substituenten R_1 bis R_7 die unter Formel I angegebenen Bedeutungen haben und Z und Y für NH_2 oder Halogen stehen, wobei in dem Fall, in dem Z für Halogen steht, Y NH_2 bedeutet und in dem Fall in dem Z für NH_2 steht, Y Halogen bedeutet.

2. Verfahren nach Anspruch 1, zur Herstellung von Verbindungen der Formel I, worin

R_1 für NO_2 oder CF_3 steht;

R_2 für NO_2 oder CF_3 steht; mit der Massgabe, dass nur R_1 oder R_2 NO_2 sein kann;

R_3 Halogen bedeutet;

R_4 für Wasserstoff oder die Gruppe $-\text{C}(\text{O})\text{R}'$ steht, wobei R' unsubstituiertes oder durch Halogen, $\text{C}_1\text{--C}_3\text{--Alkoxy}$ oder $\text{C}_1\text{--C}_3\text{--Alkylthio}$ substituiertes $\text{C}_1\text{--C}_4\text{--Alkyl}$ bedeutet;

R_5 , R_6 und R_7 unabhängig voneinander für Wasserstoff, Halogen, Nitro, Cyano, Rhodano, $\text{C}_1\text{--C}_{12}\text{--Alkyl}$, $\text{C}_3\text{--C}_8\text{--Cycloalkyl}$, $\text{C}_1\text{--C}_8\text{--Alkylthio}$, $\text{C}_1\text{--C}_8\text{--Alkylsulfonyl}$, $\text{C}_1\text{--C}_8\text{--Alkylsulfoxy}$, $\text{C}_3\text{--C}_8\text{--Alkenyl}$, $\text{C}_3\text{--C}_8\text{--Haloalkenyl}$, $\text{C}_3\text{--C}_8\text{--Alkynyl}$, $\text{C}_3\text{--C}_8\text{--Haloalkynyl}$, $\text{C}_3\text{--C}_8\text{--Alkenyloxy}$, $\text{C}_3\text{--C}_8\text{--Haloalkenyloxy}$,

C₃-C₆-Alkenylthio, C₃-C₆-Alkinyloxy, C₃-C₆-Haloalkinyloxy, durch Halogen, Cyano, und/oder C₁-C₄-Alkoxy substituiertes C₁-C₆-Alkyl, unsubstituiertes oder durch Halogen substituiertes C₁-C₆-Alkoxy, dessen Alkylteil gegebenenfalls durch ein oder mehrere einzelne Sauerstoffatome unterbrochen ist oder für die Gruppe Q-(E)_n-(X)_m stehen, wobei n für 0 oder 1 steht, m für 0 oder 1 steht, Q für ein unsubstituiertes oder durch Halogen, Nitro, C₁-C₃-Alkyl, CF₃ und/oder C₁-C₃-Alkoxy substituiertes Phenyl oder einen gesättigten oder ungesättigten fünf- oder sechsgliedrigen Heterocyclus mit einem bis drei Heteroatomen, wie Sauerstoff, Stickstoff oder Schwefel, steht, E eine C₁-C₃ Alkylenbrücke bedeutet und X für Sauerstoff oder Schwefel steht.

3. Verfahren nach Anspruch 2, zur Herstellung von Verbindungen worin R₁, R₂, R₃ und R₄ die unter Formel I angegebenen Bedeutungen haben und R₅, R₆ und R₇ unabhängig voneinander für Wasserstoff, Halogen, Nitro, Cyano, C₁-C₆-Alkyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl, C₁-C₃-Alkylthio, C₁-C₃-Alkylsulfonyl, C₁-C₃-Alkylsulfoxyl, C₃-C₄-Alkenyl, Propargyl, durch Halogen, Cyano und/oder C₁-C₃-Alkoxy substituiertes C₁-C₃-Alkyl, C₁-C₆-Alkoxy, dessen Alkylteil durch ein bis 2 einzelne Sauerstoffatome unterbrochen ist oder für die Gruppe Q-(E)_n-(X)_m stehen, worin n für 0 oder 1 und m für 0 oder 1 steht, Q für ein unsubstituiertes oder durch Halogen, Nitro, Methyl, CF₃ oder Methoxy substituiertes Phenyl oder eine Pyridylgruppe steht, E für eine Methylenbrücke steht und X Sauerstoff oder Schwefel bedeutet.

4. Verfahren nach Anspruch 3, zur Herstellung von Verbindungen der Formel I, worin R₁, R₂ und R₃ die unter Formel I angegebenen Bedeutungen haben, R₄ für Wasserstoff steht, und R₅, R₆ und R₇ unabhängig voneinander für Wasserstoff, Halogen, Nitro, Cyano, C₁-C₆-Alkyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl, C₁-C₃-Alkylthio, C₁-C₃-Alkylsulfonyl, C₁-C₃-Alkylsulfoxyl, C₃-C₄-Alkenyl, Propargyl durch Halogen, Cyano und/oder C₁-C₃-Alkoxy substituiertes C₁-C₃-Alkyl, C₁-C₆-Alkoxy, dessen Alkylteil durch ein bis 2 einzelne Sauerstoffatome unterbrochen ist oder für die Gruppe Q-(E)_n-(X)_m stehen, worin n für 0 oder 1 und m für 0 oder 1 steht, Q für ein unsubstituiertes oder durch Halogen, Nitro, Methyl, CF₃ oder Methoxy substituiertes Phenyl oder eine Pyridylgruppe steht, E für eine Methylenbrücke steht und X Sauerstoff oder Schwefel bedeutet.

5. Verfahren nach Anspruch 4, zur Herstellung von Verbindungen der Formel I, worin R₁ für NO₂ oder CF₃ steht; mit der Massgabe, dass nur R₁ oder R₂ NO₂ sein kann; R₂ für NO₂ oder CF₃ steht; R₃ Chlor bedeutet; R₄ für Wasserstoff steht; R₅ Wasserstoff bedeutet und R₆ und R₇ unabhängig voneinander für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, C₁-C₃-Alkyl, C₁-C₃-Haloalkyl, C₁-C₃-Alkoxy, C₁-C₃-Haloalkoxy, unsubstituiertes oder durch Halogen substituiertes Phenoxy, OCH₂OCH₃, OC₂H₄OCH₃, OCH₂OC₂H₅, OC₂H₄OC₂H₅, OC₂H₄OC₂H₄OC₂H₅ oder -S-(2-Pyridyl) stehen.

6. Verfahren nach Anspruch 1, zur Herstellung einer Verbindung der Formel I, ausgewählt aus der Reihe:

- 5 N-(3'-Chlor-2',6'-dinitro-4'-trifluormethylphenyl)-2-amino-4,6-dichlorpyrimidin,
N-(3'-Chlor-2',6'-dinitro-4'-trifluormethylphenyl)-2-amino-4-chlor-6-trichlormethylpyrimidin,
N-(3'-Chlor-2',6'-dinitro-4'-trifluormethylphenyl)-2-amino-4,6-dimethylpyrimidin,
10 N-(3'-Chlor-2',6'-dinitro-4'-trifluormethylphenyl)-2-amino-4-trichlormethyl-6-(methoxyethoxy)pyrimidin,
N-(3'-Chlor-2',6'-dinitro-4'-trifluormethylphenyl)-2-amino-4-methoxy-6-(2-pyridylthio)-pyrimidin,
15 N-(3'-Chlor-2',6'-dinitro-4'-trifluormethylphenyl)-2-amino-4-trichlormethyl-6-(ethoxyethoxyethoxy)pyrimidin und
N-(3'-Chlor-2',6'-dinitro-4'-trifluormethylphenyl)-2-amino-4-methoxy-6-(4''-chlorphenoxy)-pyrimidin.
- 20

7. Mittel zur Bekämpfung oder Verhütung eines Befalls durch Schädlinge, dadurch gekennzeichnet, dass es als mindestens eine aktive Komponente eine Verbindung der Formel I zusammen mit üblichen Zuschlagstoffen und Trägermaterialien enthält.

8. Mittel gemäss Anspruch 7, dadurch gekennzeichnet, dass es als mindestens eine aktive Komponente eine Verbindung der Formel I gemäss Anspruch 2 enthält.

9. Mittel zur Bekämpfung von Mikroorganismen gemäss Anspruch 7, dadurch gekennzeichnet, dass es als mindestens eine aktive Komponente eine Verbindung der Formel I gemäss einem der Ansprüche 3 bis 5 enthält.

10. Mittel nach Anspruch 7, dadurch gekennzeichnet, dass es 0,1 bis 99% eines Wirkstoffs der Formel I, 99,9 bis 1% eines festen oder flüssigen Zusatzstoffes und 0 bis 25% eines Tensides enthält.

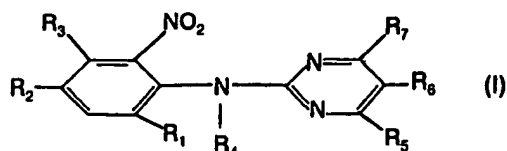
11. Mittel nach Anspruch 7, dadurch gekennzeichnet, dass es 0,1 bis 95% eines Wirkstoffs der Formel I, 99,8 bis 5% eines festen oder flüssigen Zusatzstoffes und 0,1 bis 25% eines Tensids enthält.

12. Verfahren zur Herstellung eines wie in Anspruch 7 beanspruchten agrochemischen Mittels, dadurch gekennzeichnet, dass man mindestens eine gemäss Anspruch 1 definierte Verbindung der Formel I mit geeigneten festen oder flüssigen Zusatzstoffen und Tensiden innig vermischt.

13. Verfahren zur Bekämpfung oder Verhütung eines Befalls von Kulturpflanzen durch phytopathogene Schädlinge, dadurch gekennzeichnet, dass man eine Verbindung der Formel I auf die Pflanze oder deren Standort appliziert.

Claims for the Contracting States GB, BE, DE, FR, IT, LU, NL, SE, CH, LI

1. Compounds of the general formula I



wherein

R_1 and R_2 are hydrogen, NO_2 or CF_3 , with the proviso that only R_1 or R_2 can be NO_2 ,

R_3 is halogen,

R_4 is hydrogen or the $-\text{C}(\text{O})\text{R}'$ group, in which R' is $\text{C}_1\text{--C}_4$ alkyl which is unsubstituted or substituted by halogen, $\text{C}_1\text{--C}_3$ alkoxy or $\text{C}_1\text{--C}_3$ alkylthio,

R_5 , R_6 and R_7 are each independently hydrogen, halogen, nitro, cyano, thiocyno, $\text{C}_1\text{--C}_{12}$ alkyl, $\text{C}_3\text{--C}_6$ cycloalkyl, $\text{C}_1\text{--C}_6$ alkylthio, $\text{C}_1\text{--C}_6$ alkylsulfonyl, $\text{C}_1\text{--C}_6$ alkylsulfoxyl, $\text{C}_3\text{--C}_6$ alkenyl, $\text{C}_3\text{--C}_6$ haloalkenyl, $\text{C}_3\text{--C}_6$ alkynyl, $\text{C}_3\text{--C}_6$ haloalkynyl, $\text{C}_3\text{--C}_6$ alkenyloxy, $\text{C}_3\text{--C}_6$ haloalkenyloxy, $\text{C}_3\text{--C}_6$ alkenylthio, $\text{C}_3\text{--C}_6$ alkynyloxy, $\text{C}_3\text{--C}_6$ haloalkynyloxy, $\text{C}_1\text{--C}_6$ alkyl which is substituted by halogen, cyano and/or $\text{C}_1\text{--C}_4$ alkoxy, unsubstituted $\text{C}_1\text{--C}_6$ alkoxy or halogen-substituted $\text{C}_1\text{--C}_6$ alkoxy, the alkyl moiety of which may be interrupted by one or more single oxygen atoms; or are the $\text{Q}-(\text{E})_n-(\text{X})_m$ group, in which n is 0 or 1, m is 0 or 1, Q is phenyl which is unsubstituted or substituted by halogen, nitro, $\text{C}_1\text{--C}_3$ alkyl, CF_3 and/or $\text{C}_1\text{--C}_3$ alkoxy, or is a saturated or unsaturated 5- or 6-membered heterocyclic radical containing one to three identical or different hetero atoms, such as oxygen, nitrogen or sulfur, E is a $\text{C}_1\text{--C}_3$ alkylene bridge, and X is oxygen or sulfur.

2. Compounds of the formula I according to claim 1, wherein

R_1 is NO_2 or CF_3 ,

R_2 is NO_2 or CF_3 , with the proviso that only R_1 or R_2 can be NO_2 ,

R_3 is halogen,

R_4 is hydrogen or the $-\text{C}(\text{O})\text{R}'$ group, in which R' is $\text{C}_1\text{--C}_4$ alkyl which is unsubstituted or substituted by halogen, $\text{C}_1\text{--C}_3$ alkoxy or $\text{C}_1\text{--C}_3$ alkylthio,

R_5 , R_6 and R_7 are each independently hydrogen, halogen, nitro, cyano, thiocyno, $\text{C}_1\text{--C}_{12}$ alkyl, $\text{C}_3\text{--C}_6$ cycloalkyl, $\text{C}_1\text{--C}_6$ alkylthio, $\text{C}_1\text{--C}_6$ alkylsulfonyl, $\text{C}_1\text{--C}_6$ alkylsulfoxyl, $\text{C}_3\text{--C}_6$ alkenyl, $\text{C}_3\text{--C}_6$ haloalkenyl, $\text{C}_3\text{--C}_6$ alkynyl, $\text{C}_3\text{--C}_6$ haloalkynyl, $\text{C}_1\text{--C}_6$ alkyl which is substituted by halogen, cyano and/or $\text{C}_1\text{--C}_4$ alkoxy, unsubstituted $\text{C}_1\text{--C}_6$ alkoxy or halogen-substituted $\text{C}_1\text{--C}_6$ alkoxy, the alkyl moiety of which may be interrupted by one or more single oxygen atoms; or are the $\text{Q}-(\text{E})_n-(\text{X})_m$ group, in which n is 0 or 1, m is 0 or 1, Q is phenyl which is unsubstituted or substituted by halogen, nitro, $\text{C}_1\text{--C}_3$ alkyl, CF_3 and/or $\text{C}_1\text{--C}_3$ alkoxy, or is a saturated or unsaturated 5- or 6-membered heterocyclic radical containing one to three hetero atoms, such as oxygen, nitrogen or sulfur, E is a $\text{C}_1\text{--C}_3$ alkylene bridge, and X is oxygen or sulfur.

3. Compounds of the formula I according to claim 2, wherein R_1 , R_2 , R_3 and R_4 are as defined for formula I and R_5 , R_6 and R_7 are each independently

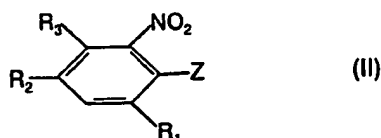
hydrogen, halogen, nitro, cyano, $\text{C}_1\text{--C}_6$ alkyl, cyclopentyl, cyclohexyl, $\text{C}_1\text{--C}_3$ alkylthio, $\text{C}_1\text{--C}_3$ alkylsulfonyl, $\text{C}_1\text{--C}_3$ alkylsulfoxyl, $\text{C}_3\text{--C}_6$ alkenyl, propargyl, $\text{C}_1\text{--C}_3$ alkyl which is substituted by halogen, cyano and/or $\text{C}_1\text{--C}_3$ alkoxy, or are $\text{C}_1\text{--C}_6$ alkoxy, the alkyl moiety of which is interrupted by 1 or 2 single oxygen atoms, or are the $\text{Q}-(\text{E})_n-(\text{X})_m$ group, in which n is 0 or 1, m is 0 or 1, Q is phenyl which is unsubstituted or substituted by halogen, nitro, methyl, CF_3 or methoxy, or is a pyridyl group, E is a methylene bridge, and X is oxygen or sulfur.

4. Compounds of the formula I according to claim 3, wherein R_1 , R_2 and R_3 are as defined for formula I, R_4 is hydrogen and R_5 , R_6 and R_7 are each independently hydrogen, halogen, nitro, cyano, $\text{C}_1\text{--C}_6$ alkyl, cyclopentyl, cyclohexyl, $\text{C}_1\text{--C}_3$ alkylthio, $\text{C}_1\text{--C}_3$ alkylsulfonyl, $\text{C}_1\text{--C}_3$ alkylsulfoxyl, $\text{C}_3\text{--C}_6$ alkenyl, propargyl, $\text{C}_1\text{--C}_3$ alkyl, which is substituted by halogen, cyano and/or $\text{C}_1\text{--C}_3$ alkoxy, $\text{C}_1\text{--C}_6$ alkoxy, the alkyl moiety of which is interrupted by 1 or 2 single oxygen atoms, or are the $\text{Q}-(\text{E})_n-(\text{X})_m$ group, in which n is 0 or 1, m is 0 or 1, Q is phenyl which is unsubstituted or substituted by halogen, nitro, methyl, CF_3 or methoxy, or is a pyridyl group, E is a methylene bridge, and X is oxygen or sulfur.

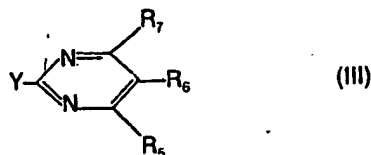
5. Compounds of the formula I according to claim 4, wherein R_1 is NO_2 or CF_3 , with the proviso that only R_1 or R_2 can be NO_2 , R_2 is NO_2 or CF_3 , R_3 is chlorine, R_4 is hydrogen, R_5 is hydrogen and R_6 and R_7 are each independently hydrogen, fluorine, chlorine, bromine, $\text{C}_1\text{--C}_3$ alkyl, $\text{C}_1\text{--C}_3$ haloalkyl, $\text{C}_1\text{--C}_3$ alkoxy, $\text{C}_1\text{--C}_3$ haloalkoxy, unsubstituted or halogen-substituted phenoxy, OCH_2OCH_3 , $\text{OC}_2\text{H}_4\text{OCH}_3$, $\text{OCH}_2\text{OC}_2\text{H}_5$, $\text{OC}_2\text{H}_4\text{OC}_2\text{H}_5$, $\text{OC}_2\text{H}_4\text{OC}_2\text{H}_4\text{OC}_2\text{H}_5$ or $-\text{S}-(2\text{-pyridyl})$.

6. A compound of the formula I according to claim 1, selected from the group consisting of:
 $\text{N}-(3'\text{-chloro-2',6'-dinitro-4'-trifluoromethylphenyl})$ -2-amino-4,6-dichloropyrimidine,
 $\text{N}-(3'\text{-chloro-2',6'-dinitro-4'-trifluoromethylphenyl})$ -2-amino-4-chloro-6-trichloromethylpyrimidine,
 $\text{N}-(3'\text{-chloro-2',6'-dinitro-4'-trifluoromethylphenyl})$ -2-amino-4,6-dimethylpyrimidine,
 $\text{N}-(3'\text{-chloro-2',6'-dinitro-4'-trifluoromethylphenyl})$ -2-amino-4-trichloromethyl-6-(methoxyethoxy)pyrimidine,
 $\text{N}-(3'\text{-chloro-2',6'-dinitro-4'-trifluoromethylphenyl})$ -2-amino-4-methoxy-6-(2-pyridylthio)pyrimidine,
 $\text{N}-(3'\text{-chloro-2',6'-dinitro-4'-trifluoromethylphenyl})$ -2-amino-4-trichloromethyl-6-(ethoxyethoxyethoxy)pyrimidine, and
 $\text{N}-(3'\text{-chloro-2',6'-dinitro-4'-trifluoromethylphenyl})$ -2-amino-4-methoxy-6-(4'-chlorophenoxy)pyrimidine.

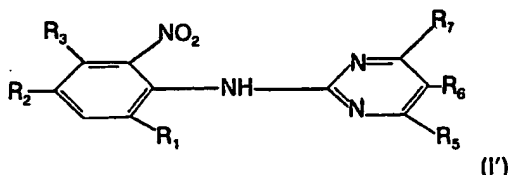
7. A process for the preparation of compounds of the formula I, which comprises reacting a compound of the formula II



with a pyrimidine derivative of the formula III



in the presence of a base, to give a compound of the formula I'



and, to obtain N-acylated derivatives, N-acylating the compound of the formula I' with a reactive derivative of the carboxylic acid IV



in which formulae the substituents R_1 to R_7 are as defined for formula I and Z and Y are NH_2 or halogen, with the proviso that, if Z is halogen, Y is NH_2 and, if Z is NH_2 , Y is halogen.

8. A composition for controlling or preventing attack by phytopathogenic pests, which contains, as at least one active component, a compound of the formula I, together with conventional adjuvants and carriers.

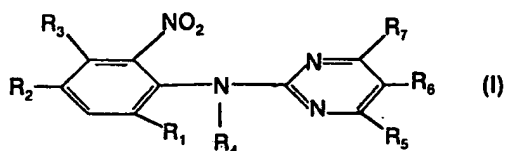
9. A composition according to claim 8, which contains, as at least one active component, a compound of the formula I according to claim 2.

10. A composition for controlling microorganisms according to claim 8, which contains, as at least one active component, a compound of the formula I according to any one of claims 3 to 6.

11. A method of controlling or preventing attacks on cultivated plants by phytopathogenic pests, which comprises applying to said plants or to the locus thereof a compound of the formula I.

Claims for the Contracting State AT

1. A process for the preparation of compounds of the formula I



wherein

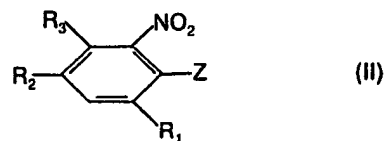
R_1 and R_2 are hydrogen, NO_2 or CF_3 , with the proviso that only R_1 or R_2 can be NO_2 ,

R_3 is halogen,

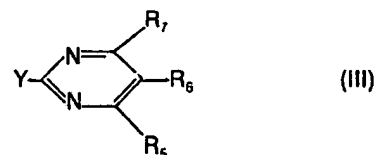
R_4 is hydrogen or the $-C(O)R'$ group, in which R' is C_1-C_4 alkyl which is unsubstituted or substituted by halogen, C_1-C_3 alkoxy or C_1-C_3 alkylthio,

R_5 , R_6 and R_7 are each independently hydrogen, halogen, nitro, cyano, thiocyno, C_1-C_{12} alkyl, C_3-C_6 cycloalkyl, C_1-C_6 alkylthio, C_1-C_6 alkylsulfonyl, C_1-C_6 alkylsulfoxy, C_3-C_6 alkenyl, C_3-C_6 haloalkenyl, C_3-C_6 alkynyl, C_3-C_6 haloalkynyl, C_3-C_6 alkenyleneoxy, C_3-C_6 haloalkenyleneoxy, C_3-C_6 alkenylthio, C_3-C_6 alkynyleneoxy, C_3-C_6 haloalkynyleneoxy, C_1-C_6 alkyl

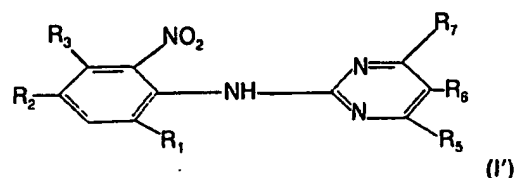
which is substituted by halogen, cyano and/or C_1-C_4 alkoxy, unsubstituted C_1-C_6 alkoxy or halo-substituted C_1-C_6 alkoxy, the alkyl moiety of which may be interrupted by one or more single oxygen atoms; or are the $Q-(E)_n-(X)_m$ group, in which n is 0 or 1, m is 0 or 1, Q is phenyl which is unsubstituted or substituted by halogen, nitro, C_1-C_3 alkyl, CF_3 and/or C_1-C_3 alkoxy, or is a saturated or unsaturated 5- or 6-membered heterocyclic radical containing one to three identical or different hetero atoms, such as oxygen, nitrogen or sulfur, E is a C_1-C_3 alkylene bridge, and X is oxygen or sulfur, which comprises reacting a compound of the formula II



with a pyrimidine derivative of the formula III



in the presence of a base, to give a compound of the formula I'



and, to obtain N-acylated derivatives, N-acylating the compound of the formula I' with a reactive derivative of the carboxylic acid IV



in which formulae the substituents R_1 to R_7 are as defined for formula I and Z and Y are NH_2 or halogen, with the proviso that, if Z is halogen, Y is NH_2 and, if Z is NH_2 , Y is halogen.

2. A process according to claim 1 for the preparation of compounds of the formula I wherein

R_1 is NO_2 or CF_3 ,
 R_2 is NO_2 or CF_3 , with the proviso that only R_1 or R_2 can be NO_2 ,

R_3 is halogen,

R_4 is hydrogen or the $-\text{C}(\text{O})\text{R}'$ group, in which R' is C_1 - C_4 alkyl which is unsubstituted or substituted by halogen, C_1 - C_3 alkoxy or C_1 - C_3 alkylthio,

R_5 , R_6 and R_7 are each independently hydrogen, halogen, nitro, cyano, thiocyno,

C_1 - C_{12} alkyl, C_3 - C_6 cycloalkyl,

C_1 - C_6 alkylthio, C_1 - C_6 alkylsulfonyl,

C_1 - C_6 alkylsulfoxyl, C_3 - C_6 alkenyl,

C_3 - C_6 haloalkenyl, C_3 - C_6 alkynyl,

C_3 - C_6 haloalkynyl, C_3 - C_6 alkenyloxy,

C_3 - C_6 haloalkenyloxy, C_3 - C_6 alkenylthio,

C_3 - C_6 alkynyloxy, C_3 - C_6 haloalkynyloxy,

C_1 - C_6 alkyl

which is substituted by halogen, cyano and/or C_1 - C_4 alkoxy, unsubstituted C_1 - C_6 alkoxy or halogen-substituted C_1 - C_6 alkoxy, the alkyl moiety of which may be interrupted by one or more single oxygen atoms; or are the $\text{Q}-(\text{E})_n-(\text{X})_m$ group, in which n is 0 or 1, m is 0 or 1, Q is phenyl which is unsubstituted or substituted by halogen, nitro, C_1 - C_3 alkyl, CF_3 and/or C_1 - C_3 alkoxy, or is a saturated or unsaturated 5- or 6-membered heterocyclic radical containing one to three hetero atoms, such as oxygen, nitrogen or sulfur, E is a C_1 - C_3 alkylene bridge, and X is oxygen or sulfur.

3. A process according to claim 2 for the preparation of compounds wherein R_1 , R_2 , R_3 and R_4 are as defined for formula I and R_5 , R_6 and R_7 are each independently

hydrogen, halogen, nitro, cyano, C_1 - C_6 alkyl,

cyclopentyl, cyclohexyl, C_1 - C_3 alkylthio,

C_1 - C_3 alkylsulfonyl, C_1 - C_3 alkylsulfoxyl,

C_3 - C_4 alkenyl, propargyl, C_1 - C_3 alkyl

which is substituted by halogen, cyano and/or C_1 - C_3 alkoxy, or are C_1 - C_6 alkoxy, the alkyl moiety of which is interrupted by 1 or 2 single oxygen atoms, or are the $\text{Q}-(\text{E})_n-(\text{X})_m-\text{U}$ group, in which n is 0 or 1, m is 0 or 1, Q is phenyl which is unsubstituted or substituted by halogen, nitro, methyl, CF_3 or methoxy, or is a pyridyl group, E is a methylene bridge, and X is oxygen or sulfur.

4. A process according to claim 3 for the preparation of compounds of the formula I wherein R_1 , R_2 and R_3 are as defined for formula I, R_4 is hydrogen and R_5 , R_6 and R_7 are each independently

hydrogen, halogen, nitro, cyano, C_1 - C_6 alkyl,

cyclopentyl, cyclohexyl, C_1 - C_3 alkylthio,

C_1 - C_3 alkylsulfonyl, C_1 - C_3 alkylsulfoxyl,

C_3 - C_4 alkenyl, propargyl, C_1 - C_3 alkyl

which is substituted by halogen, cyano and/or C_1 - C_3 alkoxy, C_1 - C_6 alkoxy, the alkyl moiety of which is interrupted by 1 or 2 single oxygen atoms, or are the $\text{Q}-(\text{E})_n-(\text{X})_m$ group, in which n is 0 or 1, m is 0 or 1, Q is phenyl which is unsubstituted or substituted by halogen, nitro, methyl, CF_3 or methoxy, or is a pyridyl group, E is a methylene bridge, and X is oxygen or sulfur.

5. A process according to claim 4 for the preparation of compounds of the formula I wherein R_1 is NO_2 or CF_3 , with the proviso that only R_1 or

R_2 can be NO_2 , R_2 is NO_2 or CF_3 , R_3 is chlorine, R_4 is hydrogen, R_5 is hydrogen and R_6 and R_7 are each independently hydrogen, fluorine, chlorine, bromine, C_1 - C_3 alkyl, C_1 - C_3 haloalkyl, C_1 - C_3 alkoxy, C_1 - C_3 haloalkoxy, unsubstituted or halogen-substituted phenoxy, OCH_2OCH_3 , $\text{OC}_2\text{H}_4\text{OCH}_3$, $\text{OCH}_2\text{OC}_2\text{H}_5$, $\text{OC}_2\text{H}_4\text{OC}_2\text{H}_5$, $\text{OC}_2\text{H}_4\text{OC}_2\text{H}_4\text{OC}_2\text{H}_5$ or $-\text{S}-(2\text{-pyridyl})$.

6. A process according to claim 1 for the preparation of a compound of the formula I selected from the group consisting of:

N-(3'-chloro-2',6'-dinitro-4'-trifluoromethyl-

phenyl)-2-amino-4,6-dichloropyrimidine,

N-(3'-chloro-2',6'-dinitro-4'-trifluoromethyl-

phenyl)-2-amino-4-chloro-6-trichloromethyl-

pyrimidine,

N-(3'-chloro-2',6'-dinitro-4'-trifluoromethyl-

phenyl)-2-amino-4,6-dimethylpyrimidine,

N-(3'-chloro-2',6'-dinitro-4'-trifluoromethyl-

phenyl)-2-amino-4-trichloromethyl-6-(methoxyethoxy)pyrimidine,

N-(3'-chloro-2',6'-dinitro-4'-trifluoromethyl-

phenyl)-2-amino-4-methoxy-6-(2-pyridylthio)-

pyrimidine,

N-(3'-chloro-2',6'-dinitro-4'-trifluoromethyl-

phenyl)-2-amino-4-trichloromethyl-6-(ethoxyethoxy)pyrimidine, and

N-(3'-chloro-2',6'-dinitro-4'-trifluoromethyl-

phenyl)-2-amino-4-methoxy-6-(4'-chlorophen-

oxy)pyrimidine.

7. A composition for controlling or preventing

attack by pests, which contains, as at least one active component, a compound of the formula I, together with conventional adjuvants and carriers.

8. A composition according to claim 7, which contains, as at least one active component, a compound of the formula I according to claim 2.

9. A composition for controlling microorganisms according to claim 7, which contains, as at least one active component, a compound of the formula I according to any one of claims 3 to 5.

10. A composition according to claim 7, which contains 0.1 to 99% of a compound of the formula I, 99.9 to 1% of a solid or liquid adjuvant, and 0 to 25% of a surfactant.

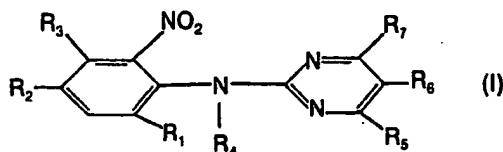
11. A composition according to claim 7, which contains 0.1 to 95% of a compound of the formula I, 99.8 to 5% of a solid or liquid adjuvant, and 0.1 to 25% of a surfactant.

12. A process for the preparation of an agrochemical composition as claimed in claim 7, which comprises intimately mixing at least one compound of the formula I as defined in claim 1 with suitable solid or liquid adjuvants and surfactants.

13. A method of controlling or preventing attacks on cultivated plants by phytopathogenic pests, which comprises applying to said plants or to the locus thereof a compound of the formula I.

Revendications pour les Etats contractants: GB, BE, DE, FR, IT, LU, NL, SE, CH, LI

1. Composés de formule générale I



dans laquelle

R₁ et R₂ représentent l'hydrogène, un groupe NO₂ ou CF₃, sous réserve qu'un seul de ces symboles R₁ ou R₂ peut représenter NO₂;

R₃ représente un halogène;

R₄ représente l'hydrogène ou le groupe -C(O)R' dans lequel R' représente un groupe alkyle en C1-C4 non substitué ou substitué pas des halogènes, des groupes alcoxy en C1-C3 ou alkylthio en C1-C3;

R₅, R₆ et R₇ représentent chacun, indépendamment les uns des autres, l'hydrogène, un halogène, un groupe nitro, cyano, sulfocyno, alkyle en C1-C12, cycloalkyle en C3-C8, alkylthio en C1-C8, alkylsulfonyl en C1-C6, alkylsulfoxy en C1-C6, alcényle en C3-C6, halogénoalcényle en C3-C6, alcynyle en C3-C6, halogénoalcynyle en C3-C6, alcényloxy en C3-C6, halogénoalcényloxy en C3-C6, alcénylthio en C3-C6, alcynyloxy en C3-C6, halogénoalcynyloxy en C3-C6, un groupe alkyle en C1-C8 substitué par des halogènes, des groupes cyano et/ou alcoxy en C1-C4, un groupe alcoxy en C1-C8 non substitué ou substitué par des halogènes et dont la partie alkyle est éventuellement interrompue par un ou plusieurs atomes d'oxygène isolés, ou le groupe Q-(E)_n-(X)_m dans lequel n est égal à 0 ou 1, m est égal à 0 ou 1, Q représente un groupe phényle non substitué ou substitué pas des halogènes, des groupes nitro, alkyle en C1-C3, CF₃ et/ou alcoxy en C1-C3, ou un hétérocycle saturé ou insaturé à 5 ou 6 chaînons contenant 1 à 3 hétéroatomes identiques ou différents tels que l'oxygène, l'azote ou le soufre, E représente un pont alkylène en C1-C3 et X représente l'oxygène ou le soufre.

2. Composés de formule I selon la revendication 1, caractérisés en ce que

R₁ représente NO₂ ou CF₃;

R₂ représente NO₂ ou CF₃; sous réserve qu'un seul des symboles R₁ et R₂ peut représenter NO₂;

R₃ représente un halogène;

R₄ représente l'hydrogène ou le groupe -C(O)R' dans lequel R' représente un groupe alkyle en C1-C4 non substitué ou substitué pas des halogènes, des groupes alcoxy en C1-C3 ou alkylthio en C1-C3;

R₅, R₆ et R₇ représentent chacun, indépendamment les uns des autres, l'hydrogène, un halogène, un groupe nitro, cyano, sulfocyno, alkyle en C1-C12, cycloalkyle en C3-C8, alkylthio en C1-C8, alkylsulfonyl en C1-C6, alkylsulfoxy en C1-C6, alcényle en C3-C6, halogénoalcényle en C3-C6, alcynyle en C3-C6, halogénoalcynyle en C3-C6, alkyle en C1-C8 substitué pas des halogènes, des groupes cyano et/ou alcoxy en C1-C4, alcoxy en C1-C8 non substitué ou substitué pas des halogènes et dont la partie alkyle est éventuellement interrompue par un ou plusieurs atomes d'oxygène isolés, ou le groupe Q-(E)_n-(X)_m

dans lequel n est égal à 0 ou 1, m est égal à 0 ou 1, Q représente un groupe phényle non substitué ou substitué pas des halogènes, des groupes nitro, alkyle en C1-C3, CF₃ et/ou alcoxy en C1-C3, ou un hétérocycle saturé ou insaturé à 5 ou 6 chaînons contenant 1 à 3 hétéroatomes tels que l'oxygène, l'azote ou le soufre, E représente un pont alkylène en C1-C3 et X représente l'oxygène ou le soufre.

3. Composés de formule I selon la revendication 2, caractérisés en ce que R₁, R₂, R₃ et R₄ ont les significations indiquées en référence à la formule I et R₅, R₆ et R₇ représentent chacun, indépendamment les uns des autres, l'hydrogène, un halogène, un groupe nitro, cyano, alkyle en C1-C6, cyclopentyle, cyclohexyle, alkylthio en C1-C3, alkylsulfonyl en C1-C3, alkylsulfoxy en C1-C3, alcényle en C3-C4, propargyle, alkyle en C1-C3 substitué par des halogènes, des groupes cyano et/ou alcoxy en C1-C3, alcoxy en C1-C6 dont la partie alkyle est interrompue par 1 à 2 atomes d'oxygène isolés, ou le groupe Q-(E)_n-(X)_m dans lequel n est égal à 0 ou 1, m est égal à 0 ou 1, Q représente un groupe phényle non substitué ou substitué pas des halogènes, des groupes nitro, méthyle, CF₃ ou méthoxy, ou un groupe pyridyle, E représente un pont méthylène et X représente l'oxygène ou le soufre.

4. Composés de formule I selon la revendication 3, caractérisés en ce que R₁, R₂ et R₃ ont les significations indiquées en référence à la formule I, R₄ représente l'hydrogène et R₅, R₆ et R₇ représentent chacun, indépendamment les uns des autres, l'hydrogène, un halogène, un groupe nitro, cyano, alkyle en C1-C6, cyclopentyle, cyclohexyle, alkylthio en C1-C3, alkylsulfonyl en C1-C3, alkylsulfoxy en C1-C3, alcényle en C3-C4, propargyle, alkyle en C1-C3 substitué par des halogènes, des groupes cyano et/ou alcoxy en C1-C3, alcoxy en C1-C6 dont la partie alkyle est interrompue par 1 à 2 atomes d'oxygène isolés, ou le groupe Q-(E)_n-(X)_m dans lequel n est égal à 0 ou 1 et m est égal à 0 ou 1, Q représente un groupe phényle non substitué ou substitué pas des halogènes, des groupes nitro, méthyle, CF₃ ou méthoxy ou un groupe pyridyle, E représente un pont méthylène et X l'oxygène ou le soufre.

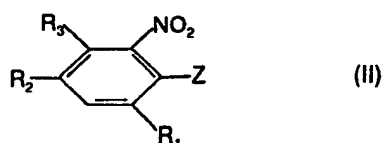
5. Composés de formule I selon la revendication 4, caractérisés en ce que R₁ représente NO₂ ou CF₃; sous réserve qu'un seul des symboles R₁ et R₂ peut représenter NO₂; R₂ représente NO₂ ou CF₃; R₃ représente le chlore; R₄ représente l'hydrogène; R₅ représente l'hydrogène et R₆ et R₇ représentent chacun, indépendamment l'un de l'autre, l'hydrogène, le fluor, le chlore, le brome, un groupe alkyle en C1-C3, halogénoalkyle en C1-C3, alcoxy en C1-C3, halogénoalcoxy en C1-C3, phénoxy non substitué ou substitué par des halogènes, OCH₂OCH₃, OC₂H₄OCH₃, OCH₂OC₂H₅, OC₂H₄OC₂H₅, ou -S-(2-pyridyle).

6. Un composé de formule I selon la revendication 1, choisi dans le groupe suivant:

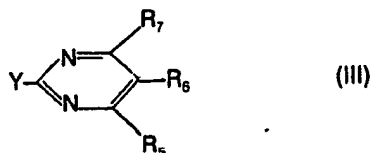
N-(3'-chloro-2',6'-dinitro-4'-trifluorométhylphényl)-2-amino-4,6-dichloropyrimidine,

N-(3'-chloro-2',6'-dinitro-4'-trifluorométhylphényl)-2-amino-4-chloro-6-trichlorométhylpyrimidine,
 N-(3'-chloro-2',6'-dinitro-4'-trifluorométhylphényl)-2-amino-4,6-diméthylpyrimidine,
 N-(3'-chloro-2',6'-dinitro-4'-trifluorométhylphényl)-2-amino-4-trichlorométhyl-6-(méthoxyéthoxy)-pyrimidine,
 N-(3'-chloro-2',6'-dinitro-4'-trifluorométhylphényl)-2-amino-4-méthoxy-6-(2-pyridylthio)-pyrimidine,
 N-(3'-chloro-2',6'-dinitro-4'-trifluorométhylphényl)-2-amino-4-trichlorométhyl-6-(éthoxyéthoxyéthoxy)-pyrimidine, et
 N-(3'-chloro-2',6'-dinitro-4'-trifluorométhylphényl)-2-amino-4-méthoxy-6-(4''-chlorophénoxy)-pyrimidine.

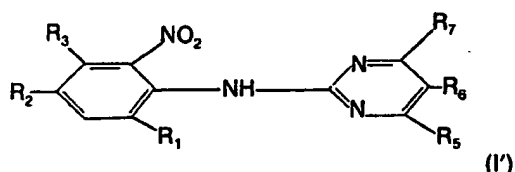
7. Procédé de préparation des composés de formule I, caractérisé en ce que l'on fait réagir un composé de formule II



en présence d'une base, avec un dérivé de la pyrimidine répondant à la formule III



ce qui donne un composé de formule I'



qu'on soumet, pour la préparation des dérivés N-acylés, à N-acylation à l'aide d'un dérivé réactif de l'acide carboxylique IV



les symboles R_1 à R_7 ayant les significations indiquées en référence à la formule I et Z et Y représentent NH_2 ou un halogène, sous réserve que, lorsque Z représente un halogène, Y représente NH_2 , et lorsque Z représente NH_2 , Y représente un halogène.

8. Produit pour combattre ou prévenir une attaque par des parasites phytopathogènes, caractérisé en ce qu'il contient au moins un composant actif consistant en un composé de formule I, avec des additifs et véhicules usuels.

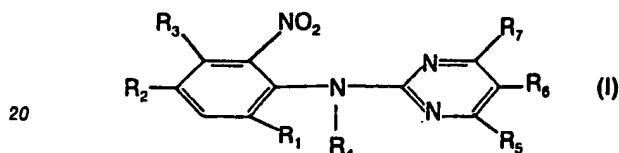
9. Produit selon la revendication 8, caractérisé en ce qu'il contient au moins un composant actif consistant en un composé de formule I selon la revendication 2.

10. Produit pour combattre les microorganismes selon la revendication 8, caractérisé en ce qu'il contient au moins un composant actif consistant en un composé de formule I selon l'une des revendications 3 à 6.

11. Procédé pour combattre ou prévenir une attaque de végétaux cultivés par des parasites phytopathogènes, caractérisé en ce que l'on applique un composé de formule I sur la plante ou son habitat.

Revendications pour l'Etat contractant: AT

1. Procédé de préparation des composés de formule I



dans laquelle

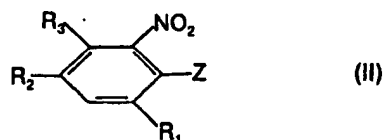
R_1 et R_2 représentent l'hydrogène, un groupe NO_2 ou CF_3 , sous réserve qu'un seul des symboles R_1 ou R_2 peut représenter NO_2 ;

R_3 représente un halogène;

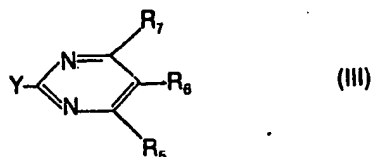
R_4 représente l'hydrogène ou le groupe $-\text{C}(\text{O})\text{R}'$ dans lequel R' représente un groupe alkyle en C1-C4 non substitué ou substitué par des halogènes, des groupes alcoxy en C1-C3 ou alkylthio en C1-C3;

R_5 , R_6 et R_7 représentent chacun, indépendamment les uns des autres, l'hydrogène, un halogène, un groupe nitro, cyano, sulfocyno, alkyle en C1-C12, cycloalkyle en C3-C8, alkylthio en C1-C8, alkylsulfonyl en C1-C6, alkylsulfoxy en C1-C6, alcényle en C3-C6, halogénoalcényle en C3-C6, alcynyle en C3-C6, halogénoalcynyle en C3-C6, alcénylène-oxy en C3-C6, halogénoalcényloxy en C3-C6, alcénylthio en C3-C6, alcényloxy en C3-C6, halogénoalcényloxy en C3-C6, un groupe alkyle en C1-C8 substitué par des halogènes, des groupes cyano et/ou alcoxy en C1-C4, un groupe alcoxy en C1-C8 non substitué ou substitué par des halogènes et dont la partie alkyle est éventuellement interrompue par un ou plusieurs atomes d'oxygène isolés, ou le groupe $\text{Q}(\text{E})_n(\text{X})_m$ dans lequel n est égal à 0 ou 1, m est égal à 0 ou 1, Q représente un groupe phényle non substitué ou substitué par des halogènes, des groupes nitro, alkyle en C1-C3, CF_3 et/ou alcoxy en C1-C3 ou un hétérocycle saturé ou insaturé à 5 ou 6 chaînons contenant 1 à 3 hétéroatomes identiques ou différents tels que l'oxygène, l'azote ou le soufre, E représente un pont alkylène en C1-C3 et X représente l'oxygène ou le soufre, caractérisé

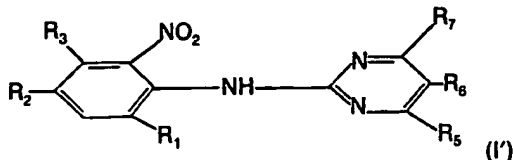
en ce que l'on fait réagir un composé de formule II



en présence d'une base, avec un dérivé de la pyrimidine répondant à la formule III



ce qui donne un composé de formule I'



qu'on soumet, pour préparation des dérivés N-acylés, à N-acylation à l'aide d'un dérivé réactif de l'acide carboxylique IV



les symboles R_1 à R_7 ayant les significations indiquées en référence à la formule I et Z et Y représentant NH_2 ou un halogène, sous réserve que lorsque Z représente un halogène, Y représente NH_2 et lorsque Z représente NH_2 , Y représente un halogène.

2. Procédé selon la revendication 1, pour la préparation des composés de formule I dans laquelle

R_1 représente NO_2 ou CF_3 ;

R_2 représente NO_2 ou CF_3 ; sous réserve qu'un seul des symboles R_1 et R_2 peut représenter NO_2 ;

R_3 représente un halogène;

R_4 représente l'hydrogène ou le groupe $-C(O)R'$ dans lequel R' représente un groupe alkyle en C1-C4 non substitué ou substitué par des halogènes, des groupes alcoxy en C1-C3 ou alkylthio en C1-C3;

R_5 , R_6 et R_7 représentent chacun, indépendamment les uns des autres, l'hydrogène, un halogène, un groupe nitro, cyano, sulfocyno, alkyle en C1-C12, cycloalkyle en C3-C8, alkylthio en C1-C8, alkylsulfonyl en C1-C6, alkylsulfoxy en C1-C6, alcényle en C3-C6, halogénoalcényle en C3-C6, alcynyle en C3-C6, halogénoalcynyle en C3-C6, alcényloxy en C3-C6, halogénoalcényloxy en C3-C6, alcénylthio en C3-C6, alcynyloxy en C3-C6, halogénoalcynyloxy en C3-C6, un groupe alkyle en C1-C8 substitué par des halogènes, des groupes cyano et/ou alcoxy en C1-C4, un groupe alcoxy en C1-C8 non substitué ou substitué pas des halogènes et dont la partie alkyle est éventuellement interrompue par un ou plusieurs atomes d'oxygène isolés, ou le groupe $Q-(E)_n-(X)_m$ dans lequel n est égal à 0 ou 1, m est égal à 0 ou 1, Q représente un groupe phényle non substitué ou substitué par des halogènes, des groupes nitro, alkyle en C1-C3, CF_3 et/ou alcoxy en C1-C3, ou un hétérocycle saturé ou insaturé à 5 ou 6 chaînons contenant 1 à 3 hétéroatomes tels que l'oxygène, l'azote ou le soufre, E représente un

pont alkylène en C1-C3 et X représente l'oxygène ou le soufre.

3. Procédé selon la revendication 2, pour la préparation de composés dans lesquels R_1 , R_2 , R_3 et R_4 ont les significations indiquées en référence à la formule I et R_5 , R_6 et R_7 représentent chacun, indépendamment les uns des autres, l'hydrogène, un halogène, un groupe nitro, cyano, alkyle en C1-C6, cyclopentyle, cyclohexyle, alkylthio en C1-C3, alkylsulfonyl en C1-C3, alkylsulfoxy en C1-C3, alcényle en C3-C4, propargyle, alkyle en C1-C3 substitué par des halogènes, des groupes cyano et/ou alcoxy en C1-C3, un groupe alcoxy en C1-C6 dont la partie alkyle est interrompue par 1 à 2 atomes d'oxygène isolés, ou le groupe $Q-(E)_n-(X)_m$ dans lequel n est égal à 0 ou 1 et m est égal à 0 ou 1, Q représente un groupe phényle non substitué ou substitué par des halogènes, des groupes nitro, méthyle, CF_3 ou méthoxy, ou un groupe pyridyle, E représente un pont méthylène et X l'oxygène ou le soufre.

4. Procédé selon la revendication 3, pour la préparation des composés de formule I dans laquelle R_1 , R_2 et R_3 ont les significations indiquées en référence à la formule I, R_4 représente l'hydrogène et R_5 , R_6 et R_7 représentent chacun, indépendamment les uns des autres, l'hydrogène, un halogène, un groupe nitro, cyano, alkyle en C1-C6, cyclopentyle, cyclohexyle, alkylthio en C1-C3, alkylsulfonyl en C1-C3, alkylsulfoxy en C1-C3, alcényle en C3-C4, propargyle, alkyle en C1-C3, substitué par des halogènes, des groupes cyano et/ou alcoxy en C1-C3, un groupe alcoxy en C1-C6 dont la partie alkyle est interrompue par 1 à 2 atomes d'oxygène isolés, ou le groupe $Q-(E)_n-(X)_m$ dans lequel n est égal à 0 ou 1 et m est égal à 0 ou 1, Q représente un groupe phényle non substitué ou substitué par des halogènes, des groupes nitro, méthyle, CF_3 ou méthoxy, ou un groupe pyridyle, E représente un pont méthylène et X l'oxygène ou le soufre.

5. Procédé selon la revendication 4, pour la préparation de composés de formule I dans laquelle R_1 représente NO_2 ou CF_3 ; sous réserve qu'un seul des symboles R_1 et R_2 peut représenter NO_2 ; R_2 représente NO_2 ou CF_3 ; R_3 représente le chlore; R_4 représente l'hydrogène; R_5 représente l'hydrogène et R_6 et R_7 représentent chacun, indépendamment l'un de l'autre, l'hydrogène, le fluor, le chlore, le brome, un groupe alkyle en C1-C3, halogénoalkyle en C1-C3, alcoxy en C1-C3, halogénoalcoxy en C1-C3, phénoxy non substitué ou substitué par des halogènes, un groupe OCH_2OCH_3 , $OC_2H_4OCH_3$, $OCH_2OC_2H_5$, $OC_2H_4OC_2H_5$, $OC_2H_4OC_2H_4OC_2H_5$ ou $-S-(2\text{-pyridyle})$.

6. Procédé selon la revendication 1, pour la préparation d'un composé de formule I choisi dans le groupe suivant:

N-(3'-chloro-2',6'-dinitro-4'-trifluorométhylphényl)-2-amino-4,6-dichloropyrimidine,

N-(3'-chloro-2',6'-dinitro-4'-trifluorométhylphényl)-2-amino-4-chloro-6-trichlorométhylpyrimidine,

N-(3'-chloro-2',6'-dinitro-4'-trifluorométhylphényl)-2-amino-4,6-diméthylpyrimidine,

N-(3'-chloro-2',6'-dinitro-4'-trifluorométhylphényl)-2-amino-4-trichlorométhyl-6-(méthoxyéthoxy)-pyrimidine,

N-(3'-chloro-2',6'-dinitro-4'-trifluorométhylphényl)-2-amino-4-méthoxy-6-(2-pyridylthio)-pyrimidine,

N-(3'-chloro-2',6'-dinitro-4'-trifluorométhylphényl)-2-amino-4-trichlorométhyl-6-(éthoxyéthoxyéthoxy)-pyrimidine, et

N-(3'-chloro-2',6'-dinitro-4'-trifluorométhylphényl)-2-amino-4-méthoxy-6-(4''-chlorophénoxy)-pyrimidine.

7. Produit pour combattre ou prévenir une attaque par des parasites, caractérisé en ce qu'il contient au moins un composant actif consistant en un composé de formule I avec des additifs et véhicules usuels.

8. Produit selon la revendication 7, caractérisé en ce qu'il contient au moins un composant actif consistant en un composé de formule I selon la revendication 2.

9. Produit pour combattre les microorganismes selon la revendication 7, caractérisé en ce qu'il

contient au moins un composant actif consistant en un composé de formule I selon l'une des revendications 3 à 5.

10. Produit selon la revendication 7, caractérisé en ce qu'il contient de 0,1 à 99% d'une substance active de formule I, de 99,9 à 1% d'un additif solide ou liquide et de 0 à 25% d'un agent tensioactif.

11. Produit selon la revendication 7, caractérisé en ce qu'il contient de 0,1 à 95% d'une substance active de formule I, de 99,8 à 5% d'un additif solide ou liquide et de 0,1 à 25% d'un agent tensioactif.

12. Procédé de préparation d'un produit agrochimique tel que revendiqué dans la revendication 7, caractérisé en ce que l'on mélange intimement au moins un composé de formule I selon la revendication 1 avec des additifs solides ou liquides appropriés et des agents tensioactifs.

13. Procédé pour combattre ou prévenir une attaque de végétaux cultivés par des parasites phytopathogènes, caractérisé en ce que l'on applique un composé de formule I sur la plante ou son habitat.

25

30

35

40

45

50

55

60

65

27